

PATENT ABSTRACTS OF JAPAN

(11)Publication number : 10-007658

(43)Date of publication of application : 13.01.1998

(51)Int.Cl.

C07D231/40
 A61K 31/415
 A61K 31/415
 A61K 31/415
 A61K 31/415
 A61K 31/415
 A61K 31/415
 A61K 31/415
 A61K 31/415
 A61K 31/415
 A61K 31/415
 A61K 31/44
 C07D231/38
 C07D401/04
 C07D405/04
 C07D409/04

(21)Application number : 09-056883

(71)Applicant : SUMITOMO PHARMACEUT CO LTD

(22)Date of filing : 24.02.1997

(72)Inventor : MATSUSHITA YOSHIYO
 HASEGAWA HIROHIKO
 KURIBAYASHI YOSHIKAZU
 OHASHI NAOHITO

(30)Priority

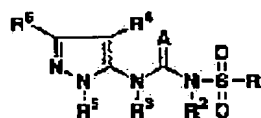
Priority number : 08 65498 Priority date : 26.02.1996 Priority country : JP

(54) DERIVATIVE OF SULFONYL UREIDOPYRAZOLE

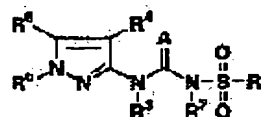
(57)Abstract:

PROBLEM TO BE SOLVED: To obtain the new subject compound having inhibiting action for an endoserine transforming enzyme and useful for curing agents and therapeutic agents for various diseases such as circular diseases, trachea contraction, etc., caused by endoserine.

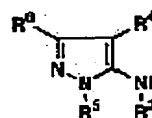
SOLUTION: This derivative of sulfonyl ureidopyrazole is a compound expressed by formula I or II (A is O or S; R¹ is an alkyl, alkenyl, aryl, etc.; R² and R³ are each H, an alkyl, an alkenyl, an aryl, a heteroarylalkyl, etc.; R⁴ and R⁶ are each H, a halogen, cyano, nitro, alkyl, etc.; R⁵ is H, an alkyl, an alkenyl, an alkynyl, a heterocyclic group, etc.) or its pharmaceutically allowable acid added salt or an alkali added salt and e.g. 4-cyano-1-phenyl-5-[(3-benzenesulfonyl)-ureide]-(1H)-pyrazole, etc., are cited. The compound of formula I is obtained by reacting a reaction product of a compound of formula III with a compound of formula IV with a compound of the formula R²'-W (R²' is the same] with R² but except H; W is a releasing group).



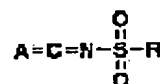
I



II



III



IV

LEGAL STATUS

[Date of request for examination]

[Date of sending the examiner's decision of rejection]

[Kind of final disposal of application other than the examiner's decision of rejection or application converted registration]

[Date of final disposal for application]

[Patent number]

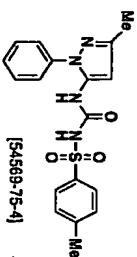
[Date of registration]

[Number of appeal against examiner's decision of rejection]

[Date of requesting appeal against examiner's decision of rejection]

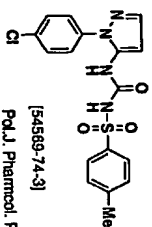
[Date of extinction of right]

Copyright (C); 1998,2003 Japan Patent Office



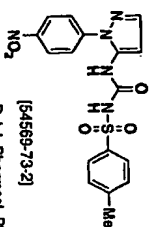
Pol. J. Pharmacol. Pharm., 479, 26(4), (1974),

[附 16]



[54569-74-3]
Pol.J. Pharmacol. Pharm., 479, 26(4), (1974)

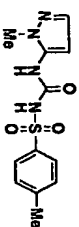
【化 1 7】



[54569-73-2]
Pol.J. Pharmacol. Pharm., 479, 28(4), (1974)

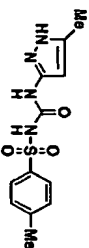
または

【化 18】



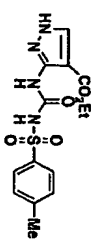
[54569-72-1]

Pol.J. Pharmacol. Pharm., 479, 26(4), (1974)



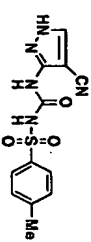
[144849-11-6]
學術報告名城大學農學院
49, 28, (1992)

【附 21】



[144849-10-5]
學術報告名城大學農学部
49, 28, (1992)

【化22】



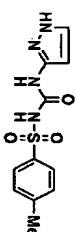
[144849-09-2]
學術報告名城大學農学部
49, 28, (1992)

または

【化23】

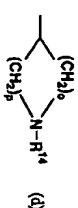
(6)

待開平 10-7658



[144849-08-1]
學術報告名城大學農学部
48, 28, (1992)

【北26】



で表される化合物

(i) R¹ が 2-メチルフェニル基でかつ、R⁵ が水素である化合物

(ii) R¹ が置換又は無置換ビニル基である化合物

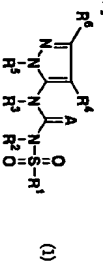
(iv) R¹ が置換ヘテロアールキル基である化合物で表される3-アロキシルライド (11H)-ヒソール誘導体またはそれらの異性体に許容される類似物またはアルキル付加物。

【請求項6】 R^1 がアリール基、置換アリール基、アルキル基、置換アルキル基、シクロアルキル基、置換シクロアルキル基または置換アルキル基であり、 R^2 および R^3 はそれぞれ同一または異なっているもよ

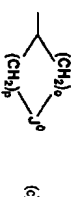
く、各々水素原子、アルキル基、置換アルキル基またはアラルキル基であり、
Rが水素原子またはシロ¹基でありR²がアルキル基、シクロアルキル基、アリール基、置換アルキル基、置換シクロアルキル基、置換アリール基または式(a)で表される基であり、

R6が酸素原子、アルキル基、置換アルキル基、アリール基または置換アリール基である請求項5記載の化合物またはそれらの薬学的に許容される酢付加塩もしくはアルカリ付加塩

【請求項7】 一般式（1）

[illegible]

【化25】



もしくは式 (d)

を喪す。 R_2 および R_3 はそれぞれ同一または異なつて

[illegible]

(d) を表す。Rは水素原子、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、アルキル基、アルケニル基、アルキニル基、シクロアルキル基、シクロアルキルアルキル基、シクロアルケニル基、シクロアルケニルアルキル基、アリール基、アリール基、ヘテロ環基、ヘテロアリールアルキル基、 $-N(R^{12})R^{13}$ 、 $-OR^{12}$ 、 $-S(O)1$

$$\begin{aligned} & -R^{12}, -CO_2-R^{12}, -CO-R^{12}, -CS- \\ & R^{12}, -O-CO-R^{12}, -CON(R^{12})R^{13}, -O \\ & SO_2-R^{12}, -SO_2-N(R^{12})R^{13}, -N \\ & (R^{12}), -CO-R^{13}, \text{置換アルキル基}, \text{置換アルケニル基}, \text{置換アルキニル基}, \text{置換シクロアルキル基}, \text{置換} \end{aligned}$$

(d) を要す。円尺は、アルキル基、アリールニル基、フェルキニル基、シクロアルキル基、シクロアリールニル基、置換シクロアルキル基、置換アリールニル基、置換フェルキニル基、置換ヘテロ環系または置換ヘテロアリールアルキル基を要するか、または前記式(c)もしくは(b)

R¹₃, -CO-N(R¹²) R¹³, 置換アルキル基、環状ジアルキル基、置換シクロアルキル基、シクロアルケニル基、シクロアルケニルアルキル基、アリール基、アラルキル基、ヘテロ環基、ヘテロアラキル基、ス(O) | -R¹², -CO-R¹², -CS-R¹², -CON(R¹²)

ルキル基、置換シクロアルケニル基、置換シクロアルキル基、置換シクロアルケニルアルキル基、置換アリール基、置換アラルキル基、置換ヘテロ環基、置換ヘテロアリールアルキル基を表すか、または前記式 (○) もしくは (d) を表す。R⁶ は水素原子、ハロゲン原子、

シアノ基、ニトロ基、アルキル基、アルケニル基、アルキル基、シクロアルキル基、シクロアルキルアルキル

いる。また、レイノー患者、バーンジャー病患者、高尿酸血症者、川崎病患者、シスチナジ、投与時の腎臓病患者の血中などにおいてET濃度は正常人に比して有意に高いことが知られている。ETは多くの生成において、活性の低い前駆体であるビッグエンジン(以下、big ETと略す)から特異的プロテアーゼであるET変換酵素(ECEと略す)により生成される。従って、ECEを阻害しETの生成を抑えることは上記の各種疾患の治療および予防に有効であると考えられる。これまで、ECEを阻害する化合物としてはトリスベシス、タナセンジン等の放線菌として生産されるホスホラミドが知られていて、学術研究会城大学薬学館(1992)、第28巻、49-59頁、特開平1-475757、特開昭62-148482、Indian J. Chem., sect. B(1986)、258 (9) 934-938、Pol. J. Pharmacol., Pharm. (1974)、26(4)、479-492、W092(104861)はヌルホリドピロゾール誘導体が発見されているが、そのエンボセン変換酵素阻害剤としての作用は全く不明であった。

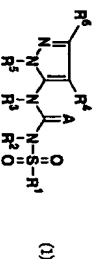
【0003】

【説明が解決しようとする課題】上記理由から、ECEを阻害する物質の解明が求めらるるところであり、そしてこのECEを阻害する物質の解明によりて、ETに起因する、または起因すると考えられる各種疾患、例えば循環器系の疾患（例えば心筋虚血、うつ血性心不全、不整脈、不安定狭心症、心肥大、高血圧）、気管収縮（肺は高血圧、喘息）、神経性哮喘（喘息管気腫、くも膜下出血、脳卒中、脳梗塞、アルツハイマー病）、分娩系不全（子宮虚脱）、血管障害（動脈硬化、パーキンソン病、高血圧性脳出血）、腎臓病の急性性、潰瘍（胃潰瘍）、腫瘍（肺ガン）、胃腸障害、エントロキシンショック、敗血症、腎障害（急性および慢性腎不全）などの治療薬および予防薬の新たな開発の可能性が開かれることになる。すなわち本発明は、ECEを阻害する物質の解明と、このECEの阻害作用に基づいた上記各種疾患の治療薬および予防剤の開発とを課題とするものである。

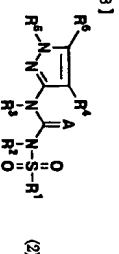
【0004】

【課題を解決するための手段】本発明者らは、E.T波被曝時色素阻害剤について鋭意研究を試みた結果、下記一般式(1)で示される化合物が上記の公知化合物よりも格段に優れた阻害活性を有することを見出し、本発明を完成するに至る。

①一般式(1)もしくは(2)



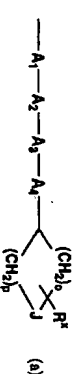
【4532】



【化33】

(2)

〔式中、Rは酸素原子または硫黄原子を表す。R¹はアルキル基、アルケニル基、アリール基、シクロアルキル基、シクロアルケニル基、アリール基、ヘテロアリール基、アルキル基、ヘテロ環基、-OR¹、-SR¹、-N(R¹)、R¹、置換アルキル基、置換アルケニル基、置換アルキニル基、置換シクロアルキル基、置換シクロアルケニル基、置換シクロアルケニル基、置換アリール基、置換アリールケニル基、置換ヘテロアリールアルキル基、または置換ヘテロ環基を表すか、または式 (a) 〕



【1534】



もしくは式 (b)
【化35】

を扱う。R² および R³ はそれぞれ同一または異なる
いてもよく、各々水素原子、アルキル基、アルケニ
基、アリール基、シクロアルキル基、シクロアルケ
ニル基、アールキル基、ヘテロアルキル基、ヘテロ
アルケニル基、置換アルケニル基、置換アルキ
ニル基、置換シクロアルキル基、置換シクロアルケ
ニル基、置換シクロアルケニル基、置換シクロアル
ケニル基、置換アリール基、置換アルキル基、置
換シクロアルキル基、もしくは置換ヘテロアルキル
基を意味、または前記式 (a) もしくは (b) を表

す。R4およびR6 はそれぞれ同一または異なる任意の置換基である。R4およびR6は、それぞれ、 H 、 C_1H_5 、 C_2H_5 、 C_3H_7 、 C_4H_9 、 C_6H_{13} 、 C_8H_{17} 、 $\text{C}_{10}\text{H}_{21}$ 、 $\text{C}_{12}\text{H}_{25}$ 、 $\text{C}_{14}\text{H}_{29}$ 、 $\text{C}_{16}\text{H}_{33}$ 、 $\text{C}_{18}\text{H}_{37}$ 、 $\text{C}_{20}\text{H}_{41}$ 、 $\text{C}_{22}\text{H}_{45}$ 、 $\text{C}_{24}\text{H}_{49}$ 、 $\text{C}_{26}\text{H}_{53}$ 、 $\text{C}_{28}\text{H}_{57}$ 、 $\text{C}_{30}\text{H}_{61}$ 、 $\text{C}_{32}\text{H}_{65}$ 、 $\text{C}_{34}\text{H}_{69}$ 、 $\text{C}_{36}\text{H}_{73}$ 、 $\text{C}_{38}\text{H}_{77}$ 、 $\text{C}_{40}\text{H}_{81}$ 、 $\text{C}_{42}\text{H}_{85}$ 、 $\text{C}_{44}\text{H}_{89}$ 、 $\text{C}_{46}\text{H}_{93}$ 、 $\text{C}_{48}\text{H}_{97}$ 、 $\text{C}_{50}\text{H}_{101}$ 、 $\text{C}_{52}\text{H}_{105}$ 、 $\text{C}_{54}\text{H}_{109}$ 、 $\text{C}_{56}\text{H}_{113}$ 、 $\text{C}_{58}\text{H}_{117}$ 、 $\text{C}_{60}\text{H}_{121}$ 、 $\text{C}_{62}\text{H}_{125}$ 、 $\text{C}_{64}\text{H}_{129}$ 、 $\text{C}_{66}\text{H}_{133}$ 、 $\text{C}_{68}\text{H}_{137}$ 、 $\text{C}_{70}\text{H}_{141}$ 、 $\text{C}_{72}\text{H}_{145}$ 、 $\text{C}_{74}\text{H}_{149}$ 、 $\text{C}_{76}\text{H}_{153}$ 、 $\text{C}_{78}\text{H}_{157}$ 、 $\text{C}_{80}\text{H}_{161}$ 、 $\text{C}_{82}\text{H}_{165}$ 、 $\text{C}_{84}\text{H}_{169}$ 、 $\text{C}_{86}\text{H}_{173}$ 、 $\text{C}_{88}\text{H}_{177}$ 、 $\text{C}_{90}\text{H}_{181}$ 、 $\text{C}_{92}\text{H}_{185}$ 、 $\text{C}_{94}\text{H}_{189}$ 、 $\text{C}_{96}\text{H}_{193}$ 、 $\text{C}_{98}\text{H}_{197}$ 、 $\text{C}_{100}\text{H}_{201}$ 、 $\text{C}_{102}\text{H}_{205}$ 、 $\text{C}_{104}\text{H}_{209}$ 、 $\text{C}_{106}\text{H}_{213}$ 、 $\text{C}_{108}\text{H}_{217}$ 、 $\text{C}_{110}\text{H}_{221}$ 、 $\text{C}_{112}\text{H}_{225}$ 、 $\text{C}_{114}\text{H}_{229}$ 、 $\text{C}_{116}\text{H}_{233}$ 、 $\text{C}_{118}\text{H}_{237}$ 、 $\text{C}_{120}\text{H}_{241}$ 、 $\text{C}_{122}\text{H}_{245}$ 、 $\text{C}_{124}\text{H}_{249}$ 、 $\text{C}_{126}\text{H}_{253}$ 、 $\text{C}_{128}\text{H}_{257}$ 、 $\text{C}_{130}\text{H}_{261}$ 、 $\text{C}_{132}\text{H}_{265}$ 、 $\text{C}_{134}\text{H}_{269}$ 、 $\text{C}_{136}\text{H}_{273}$ 、 $\text{C}_{138}\text{H}_{277}$ 、 $\text{C}_{140}\text{H}_{281}$ 、 $\text{C}_{142}\text{H}_{285}$ 、 $\text{C}_{144}\text{H}_{289}$ 、 $\text{C}_{146}\text{H}_{293}$ 、 $\text{C}_{148}\text{H}_{297}$ 、 $\text{C}_{150}\text{H}_{301}$ 、 $\text{C}_{152}\text{H}_{305}$ 、 $\text{C}_{154}\text{H}_{309}$ 、 $\text{C}_{156}\text{H}_{313}$ 、 $\text{C}_{158}\text{H}_{317}$ 、 $\text{C}_{160}\text{H}_{321}$ 、 $\text{C}_{162}\text{H}_{325}$ 、 $\text{C}_{164}\text{H}_{329}$ 、 $\text{C}_{166}\text{H}_{333}$ 、 $\text{C}_{168}\text{H}_{337}$ 、 $\text{C}_{170}\text{H}_{341}$ 、 $\text{C}_{172}\text{H}_{345}$ 、 $\text{C}_{174}\text{H}_{349}$ 、 $\text{C}_{176}\text{H}_{353}$ 、 $\text{C}_{178}\text{H}_{357}$ 、 $\text{C}_{180}\text{H}_{361}$ 、 $\text{C}_{182}\text{H}_{365}$ 、 $\text{C}_{184}\text{H}_{369}$ 、 $\text{C}_{186}\text{H}_{373}$ 、 $\text{C}_{188}\text{H}_{377}$ 、 $\text{C}_{190}\text{H}_{381}$ 、 $\text{C}_{192}\text{H}_{385}$ 、 $\text{C}_{194}\text{H}_{389}$ 、 $\text{C}_{196}\text{H}_{393}$ 、 $\text{C}_{198}\text{H}_{397}$ 、 $\text{C}_{200}\text{H}_{401}$ 、 $\text{C}_{202}\text{H}_{405}$ 、 $\text{C}_{204}\text{H}_{409}$ 、 $\text{C}_{206}\text{H}_{413}$ 、 $\text{C}_{208}\text{H}_{417}$ 、 $\text{C}_{210}\text{H}_{421}$ 、 $\text{C}_{212}\text{H}_{425}$ 、 $\text{C}_{214}\text{H}_{429}$ 、 $\text{C}_{216}\text{H}_{433}$ 、 $\text{C}_{218}\text{H}_{437}$ 、 $\text{C}_{220}\text{H}_{441}$ 、 $\text{C}_{222}\text{H}_{445}$ 、 $\text{C}_{224}\text{H}_{449}$ 、 $\text{C}_{226}\text{H}_{453}$ 、 $\text{C}_{228}\text{H}_{457}$ 、 $\text{C}_{230}\text{H}_{461}$ 、 $\text{C}_{232}\text{H}_{465}$ 、 $\text{C}_{234}\text{H}_{469}$ 、 $\text{C}_{236}\text{H}_{473}$ 、 $\text{C}_{238}\text{H}_{477}$ 、 $\text{C}_{240}\text{H}_{481}$ 、 $\text{C}_{242}\text{H}_{485}$ 、 $\text{C}_{244}\text{H}_{489}$ 、 $\text{C}_{246}\text{H}_{493}$ 、 $\text{C}_{248}\text{H}_{497}$ 、 $\text{C}_{250}\text{H}_{501}$ 、 $\text{C}_{252}\text{H}_{505}$ 、 $\text{C}_{254}\text{H}_{509}$ 、 $\text{C}_{256}\text{H}_{513}$ 、 $\text{C}_{258}\text{H}_{517}$ 、 $\text{C}_{260}\text{H}_{521}$ 、 $\text{C}_{262}\text{H}_{525}$ 、 $\text{C}_{264}\text{H}_{529}$ 、 $\text{C}_{266}\text{H}_{533}$ 、 $\text{C}_{268}\text{H}_{537}$ 、 $\text{C}_{270}\text{H}_{541}$ 、 $\text{C}_{272}\text{H}_{545}$ 、 $\text{C}_{274}\text{H}_{549}$ 、 $\text{C}_{276}\text{H}_{553}$ 、 $\text{C}_{278}\text{H}_{557}$ 、 $\text{C}_{280}\text{H}_{561}$ 、 $\text{C}_{282}\text{H}_{565}$ 、 $\text{C}_{284}\text{H}_{569}$ 、 $\text{C}_{286}\text{H}_{573}$ 、 $\text{C}_{288}\text{H}_{577}$ 、 $\text{C}_{290}\text{H}_{581}$ 、 $\text{C}_{292}\text{H}_{585}$ 、 $\text{C}_{294}\text{H}_{589}$ 、 $\text{C}_{296}\text{H}_{593}$ 、 $\text{C}_{298}\text{H}_{597}$ 、 $\text{C}_{300}\text{H}_{601}$ 、 $\text{C}_{302}\text{H}_{605}$ 、 $\text{C}_{304}\text{H}_{609}$ 、 $\text{C}_{306}\text{H}_{613}$ 、 $\text{C}_{308}\text{H}_{617}$ 、 $\text{C}_{310}\text{H}_{621}$ 、 $\text{C}_{312}\text{H}_{625}$ 、 $\text{C}_{314}\text{H}_{629}$ 、 $\text{C}_{316}\text{H}_{633}$ 、 $\text{C}_{318}\text{H}_{637}$ 、 $\text{C}_{320}\text{H}_{641}$ 、 $\text{C}_{322}\text{H}_{645}$ 、 $\text{C}_{324}\text{H}_{649}$ 、 $\text{C}_{326}\text{H}_{653}$ 、 $\text{C}_{328}\text{H}_{657}$ 、 $\text{C}_{330}\text{H}_{661}$ 、 $\text{C}_{332}\text{H}_{665}$ 、 $\text{C}_{334}\text{H}_{669}$ 、 $\text{C}_{336}\text{H}_{673}$ 、 $\text{C}_{338}\text{H}_{677}$ 、 $\text{C}_{340}\text{H}_{681}$ 、 $\text{C}_{342}\text{H}_{685}$ 、 $\text{C}_{344}\text{H}_{689}$ 、 $\text{C}_{346}\text{H}_{693}$ 、 $\text{C}_{348}\text{H}_{697}$ 、 $\text{C}_{350}\text{H}_{701}$ 、 $\text{C}_{352}\text{H}_{705}$ 、 $\text{C}_{354}\text{H}_{709}$ 、 $\text{C}_{356}\text{H}_{713}$ 、 $\text{C}_{358}\text{H}_{717}$ 、 $\text{C}_{360}\text{H}_{721}$ 、 $\text{C}_{362}\text{H}_{725}$ 、 $\text{C}_{364}\text{H}_{729}$ 、 $\text{C}_{366}\text{H}_{733}$ 、 $\text{C}_{368}\text{H}_{737}$ 、 $\text{C}_{370}\text{H}_{741}$ 、 $\text{C}_{372}\text{H}_{745}$ 、 $\text{C}_{$

$\text{O}2-\text{N}(\text{R}^{12})\text{R}^{13}$, $-\text{N}(\text{R}^{12})-\text{CO}-\text{R}^{13}$, $-\text{OSO}_2-\text{R}^{12}$, 置換アルキル基、置換アルケニル基、置換アリール基、置換シクロロアルケン基、置換シクロプロピル基、置換シクロブチル基、置換シクロペンチル基、置換シクロヘキサール基、置換アラルキル基、置換アテトロアリール基、もしくは置換ヘテロ環基を表すか、または前記式(a)もしくは(b)を致す。 R^{H} は、水素原子、アルキル基、アルケニル基、アリール基、ヘテロ環基、ヘテロアリール基、 $-\text{CO}-\text{R}^{12}$, $-\text{CS}-\text{R}^{12}$, $-\text{CO}_2-\text{R}^{12}$, $-\text{CO}-\text{S}(\text{R}^{12})-\text{CO}_2-\text{R}^{12}$, $-\text{CS}-\text{O}-\text{R}^{12}$, $-\text{CON}(\text{R}^{12})\text{R}^{13}$, $-\text{CSN}(\text{R}^{12})\text{R}^{13}$, $-\text{S}(\text{O})_1-\text{R}^{12}$, もしくは $-\text{SO}_2-\text{N}(\text{R}^{12})\text{R}^{13}$, 置換アルキル基、置換アルケニル基、置換アリール基、置換シクロロアルケン基、置換シクロプロピル基、置換シクロブチル基、置換シクロペンチル基、置換シクロヘキサール基、置換アラルキル基、置換アテトロアリール基、もしくは置換ヘテロ環基を表すか、または前記式(b)もしくは(c)を致す。前記及び後記の定義もしも(b)式において、

(6) R¹は水素原子、アルキル基、アラルケニル基、アリール基、シクロアルキル基、シクロアラルケニル基、置換アルキル基、置換アリール基、置換アラルケニル基、置換シクロアルキル基、置換シクロアラルケニル基、置換シクロアルキル基、置換アリール基、置換アラルケニル基、置換シクロアルキル基、または置換ヘテロアリールアルキル基を表す。

(7) A₅, A₆, A₇およびA₈は同一または異なって各種結合、もしくは-C(H)-を表すか、または隣り合う二つが一緒になつて-CH=CH-或いは-C≡C-を表す。

(8) R¹は-O-R⁸, -N(R⁸)R⁹, -CO-R⁸, -CS-R⁸, -CO₂-R⁸, -CO-S-R⁸, -CS₂-R⁸, -CS-O-R⁸, -O-CO-R⁸, -O-CS-R⁸, -S-CO-R⁸, -S-CS-R⁸, -CON(R⁸)R⁹, -CSN(R⁸)R⁹, -S(O)I-R⁸, -SO₂-N(R⁸)R⁹, -O-CO₂-R⁸ または-N(R⁸)-CO-R⁸を表す。

(1) R及びR'は同一または互いに独立して水素原子、アルキル基、アラルケニル基、アリール基、シクロアルキル基、シクロアルケン基、シリール基、ヘテロアルキル基、ヘテロ環基、置換アルキル基、置換シクロアルキル基、置換アリール基、置換シクロアルケニル基、置換シリール基、置換シクロアルケニル基、置換シリール基、置換アルキル基を数す。ただし、-N(R')のR'の場合に、R及びR'が互いに結合して、それらから結合する窒素原子と共に、環中に他のヘテロ原子を含んでもよい飽和3ないし8員環を数してもよい。

(2) A₁, A₂, A₃, およびA₄は同一または異なる二つ各々単独もしくは、-CH=CH-を数すか、または繰り返し合う二つの一組になって-CH=C(CH₃)-取いは-C≡C-を数す。

(3) R₁'はなくともよいが、1つまたは2以上あってもよく、環状或酸素原子に結合する炭素原子と置き換わる基であり、それぞれ同一または異なるプロパン原子、エノキル基、シアノ基、アルキル基、アラルケニル基、アルキニル基、シクロアルキル基、シクロアルケニル基、シクロアルケニル基、シクロアルケニル基、シリール基、アラルケニル基、ヘテロアリール基、ヘテロ環基、または-Ag-Ag'-Ar-Ag-R₁を数す。

(4) oおよびnは独立して0または1から3の整数(ただし、oは同時に0にならない)を数す。

(5) jは酸素原子、または-S(O)(q)-[式中、qは0、1、または2を数す]を数す。

[illegible]

キニル基、置換シクロアルキル基、置換シクロアルキル

アルキル基、置換シクロアルケニル基、置換シクロアル

ケニルアルキル基、置換アリール基、置換アリールキ

ル基、置換ヘテロアリールアルキル基、または置換ヘテロ

環基における置換基は、同一または異なる1個または

2個以上あってもよく、ハロゲン原子、ニトロ基、シア

ノ基、アルキル基、アルケニル基、アルキニル基、シク

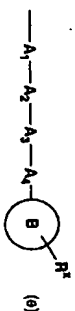
ロアルキル基、シクロアルキルアルキル基、シクロアル

ケニル基、シクロアルケニルアルキル基、アリール基、

アラルキル基、ヘテロアリールアルキル基、-A5-A6

-A7-A8-R¹、または式(e)

(化36)



(式中、B環はシクロアルキル基、シクロアルケニル

基、アリール基またはヘテロ環基を表す) から選ばれ

る。ただし、当該置換基が置換シクロアルキル基、置換

シクロアルケニル基、置換シクロアルキルアルキル基、

置換シクロアルケニルアルキル基、置換アリール基、置

換アリールアルキル基、置換ヘテロ環基、もしくは置換ヘテロ

アリールアルキル基における置換基である場合には、隣

接する炭素原子に結合する置換基どうしが結合し、該炭

素原子と一緒になって、4～8員環を形成してもよ

い、]で表される化合物またはそれらの薬学的に許容さ

れる置付加塩もしくはアルカリ付加塩を含有するエント

セリン変換酵素阻害剤、

⑨前記一般式(1)もしくは(2)で表される化合物ま

たはそれらの薬学的に許容される置付加塩もしくはアル

カリ付加塩を含有する循環器系の疾患、気管収縮、神経

性障害、分秘系不全、血管障害、潰瘍、腫瘍、胃腸障害

等、エンドキシンシヨック、敗血症、または腎臓等の

治療または予防薬、

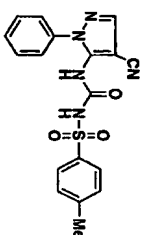
⑩前記一般式(1)で表わされる5-スルホニルウレイ

ド- (1H) -ピラゾール誘導体、(但し、以下の化合

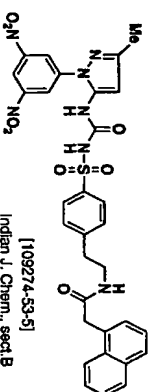
物を除く。

i) 下記式

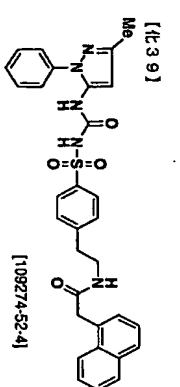
(化37)



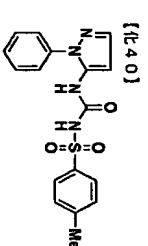
(化38)



(化39)



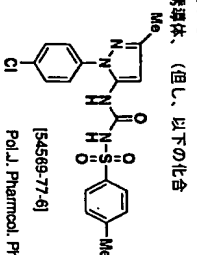
(化40)



[54569-77-6]

Pol.J. Pharmacol. Pharm., 479, 26(4), (1974)

(化41)



[54569-77-6]

Pol.J. Pharmacol. Pharm., 479, 26(4), (1974)

(化42)

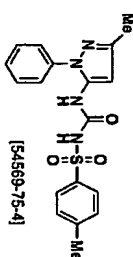
Me

NO₂

[54569-76-5]

Pol.J. Pharmacol. Pharm., 479, 26(4), (1974)

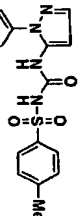
(化43)



[54569-75-4]

Pol.J. Pharmacol. Pharm., 479, 26(4), (1974)

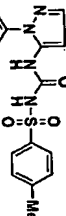
(化44)



[54569-74-3]

Pol.J. Pharmacol. Pharm., 479, 26(4), (1974)

(化45)

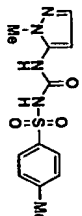


[54569-73-2]

Pol.J. Pharmacol. Pharm., 479, 26(4), (1974)

または

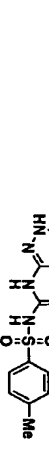
(化46)



[54569-72-1]

Pol.J. Pharmacol. Pharm., 479, 26(4), (1974)

(化47)

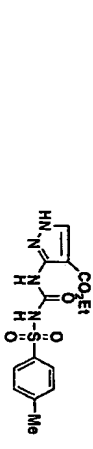


[144849-11-6]

学術報告名城大学薬学部

49, 28, (1992)

(化48)



[144849-10-5]

学術報告名城大学薬学部

48, 28, (1992)

で表される化合物

i) R¹ が2-メチルフェニル基でかつ、R⁵が外環又

はアルキル基である化合物

ii) R¹ が-N(R⁷R⁷)である化合物

iv) R¹ が置換ヘテロアリールアルキル基である化合

物) またはそれらの薬学的に許容される置付加塩もしく

はアルカリ付加塩、

⑨前記一般式(2)で表される3-スルホニルウレイド

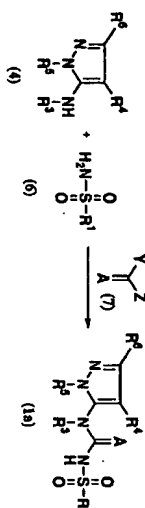
- (1H) -ピラゾール誘導体 (但し、以下の化合物を

除く、

i) 下記式

(化47)

化カリウム、水素化カルシウムなどの金属水素化物、ナトリウム、フェニルリチウム、ナトリウムエトキシド、ナトリウムトキシド、ナトリウムテートキシド、カリウムテートキシド、リチウムアミド、リチウムジエチルアルミドなどの有機金属塩、トリエチルアミン、ピリジン、ジエチルアルミニウムなどの有機塩基が、溶媒としてはベンゼン、トルエンなどの芳香族性炭化水素系溶媒、ジクロロメタン、クロロホルム、1,2-ジクロロエタンなどのハロゲン化炭化水素溶媒、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミドなどのアミド系溶媒、テトラヒドロフラン、エーテル、1,4-ジオキサン、1,2-ジメトキシエタンなどの

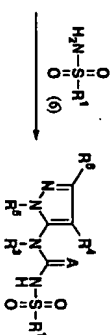
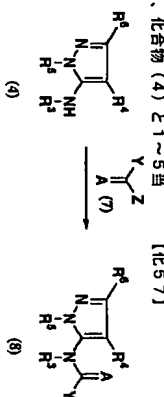


【式中、A、R¹、R³、R⁴、R⁵、R⁶は前記と同様であり、YおよびZは求核攻撃により容易に置換しうる脱離基を表す】

本反応において、使用される塩基および溶媒は前記

(B) で述べたものと同様の物が挙げられる。

(D) 本発明化合物 (1a) は、化合物 (4) と1~5当量



【式中、A、R¹、R³、R⁴、R⁵、R⁶、YおよびZは前記と同様である。】

本反応において、使用される塩基および溶媒は前記

(B) で述べたものと同様の物が挙げられる。

(E) 本発明化合物 (1a) は、化合物 (6) と1~5当量の化合物 (7) とを適当な塩基の存在下、不活性溶媒

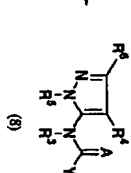
エーテル系溶媒、ピリジンなどの塩基性溶媒、またはそれらの混合溶媒が挙げられる。式 (5) で表される原料化合物は市販されているか、もしくは文献記載の方法で合成することができ。【例えば、特開昭51-26816、Tetrahedron Letters, 34, 2839, (1993)】

【0015】(C) 本発明化合物 (1a) は、化合物 (4) と1~5当量の化合物 (6) とを適当な塩基および1~5当量の化合物 (7) の存在下、不活性溶媒中、冷却下、室温または加熱下、反応させることによって得ることができる。

【化56】

量の化合物 (7) とを適当な塩基の存在下、不活性溶媒中、冷却下、室温または加熱下反応させることにより化合物 (8) とし、これを1~5当量の化合物 (6) とを適当な塩基の存在下、不活性溶媒中、冷却下、室温または加熱下反応させることにより、得ることができる。

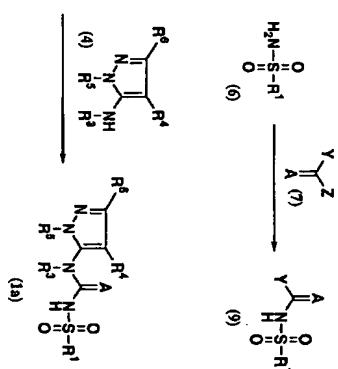
【化57】



(1a)

中、冷却下、室温または加熱下反応させることにより化合物 (9) で表される化合物を得、これと1~5当量の化合物 (4) とを適当な塩基の存在下、不活性溶媒中、冷却下、室温下、加熱下反応させることにより得ることができる。

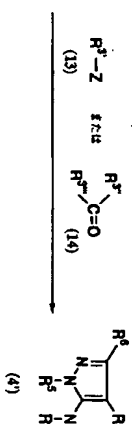
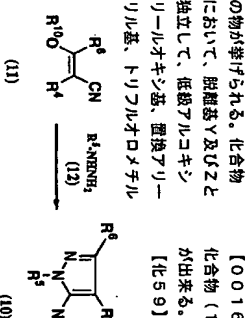
【化58】



【式中、A、R¹、R³、R⁴、R⁵、R⁶、YおよびZは前記と同様である。】

本反応において、使用される塩基および溶媒は前記

(B) で述べたものと同様の物が挙げられる。化合物 (7) 、(8) 及び (9) において、脱離基Y及びZとしては同一もしくは互いに独立して、低級アルコキシ基、アラルキロキシ基、アリールオキシ基、置換アリールオキシ基、1-イミダゾリル基、トリフルオロメチル



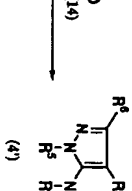
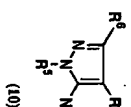
【式中、R⁴、R⁵、R⁶、Zは前記と同様であり、R³はR³と同じ意味を表し(但し水素原子は除く)、R³およびR³'''は-CH(R³)R³'''がR³(但し、α位に水素原子を持つ基に限る)と同じ意味になる様な基を表し、R¹⁰はアルキル基を表す。】

原料化合物 (4) は、化合物 (10) と1~5当量の化合物 (13) とを適当な塩基の存在下、通常用いられる溶媒中、冷却下、室温または加熱下反応させることにより得ることができるか、或いは1~5当量の化合物 (10) と化合物 (14) とを還元剤N-アルキル反応を行うことにより得ることができる。式 (10) で表される原料化合物は市販されているか、もしくは文献記載【例えば、J. Org. Chem., 21, 1240, (1956)、特開昭62-195376号、Aust. J. Chem., 42, 747, (1989)、J. Med. Chem., 3253, 35, (1992)、Chemical Abstracts 156, 1459, (1962)、米国特許第4622330号、特開昭60-115581号、J. Med. Chem., 34, 2892、

基、トリクロロメチル基、トリプロモメチル基、トリメチル基等のトリハロメチル基及びハロゲン原子等が挙げられる。

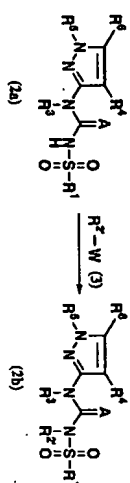
【0016】(F) 原料化合物 (4) は下記方法により化合物 (10) 及び化合物 (4') として製造することが出来る。

【化59】



(1991)、特開平6-503069号、J. Am. Chem. Soc., 81, 2456, (1959)、Chemical abstract, 79, 146518, Heterocycles, 26, 613, (1987)、J. Org. Chem., 58, 6155, (1993) の方法で合成することができるか、あるいは化合物 (11) と1~5当量の化合物 (12) とを通常用いられる溶媒中、酸或いは塩基の存在下、冷却下、室温または加熱下反応させることにより得ることができる。化合物 (10) と化合物 (13) とを反応させる場合は、塩基としては、水酸化リチウム、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸セシウム、炭酸水素ナトリウム、炭酸水素カリウム、炭酸水素セシウム、水素化ナトリウム、水素化カリウムなどの無機塩基、水素化カルシウムなどの金属水素化物、ナトリウム、フェニルリチウム、ナトリウムエトキシド、ナトリウムトキシド、カリウムトキシド、リチウムアミド、リチウムジエチルアルミドなどの有機金属塩、トリエチルアミ

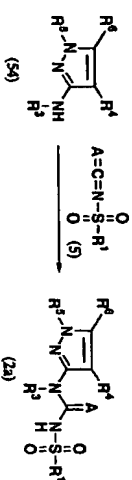
ン、ピリジン、ジエチルピロエチルアミンなどの有機塩基が、溶媒としてはベンゼン、トルエンなどの芳香族性炭化水素系溶媒、ジクロロメタン、クロロホルム、1,2-ジクロロエタンなどのハロゲン化炭化水素系溶媒、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミドなどのアミド系溶媒、テトラヒドロフラン、エーテル、1,4-ジオキサン、1,2-ジメトキシエタンなどのエーテル系溶媒、ピリジンなどの塩基性溶媒、またはそれらの混合溶媒が挙げられる。化合物(10)を化合物(14)で還元剤 N-アルキル化を行う場合は、化合物(10)と化合物(14)を水素化シアンほう素ナトリウム



および適当な酸の存在下、一般的に用いられる溶媒中、冷却下、室温下または加熱下反応させることにより得ることができるか、或いは化合物(10)と化合物(14)を適当な酸および触媒の存在下、水素雰囲気下で接触還元反応を行うことにより得ることができる。
[0017] (G) 本発明化合物(2b)は、化合物(2a)と1~5当量の化合物(3)とを適当な塩基の存在下、通常用いられる溶媒中、冷却下、室温下または加熱下反応させることにより、合成することができる。
[化60]

[式中、A、R¹、R²、R³、R⁴、R⁵、R⁶、Wは前記と同様である。]

本反応で使用する溶媒および溶媒としては前記(A)で述べたものと同様のものが挙げられる。一般式(2a)で表される本発明化合物は、例えば以下(H)~(K)に示す方法によって製造することができる。

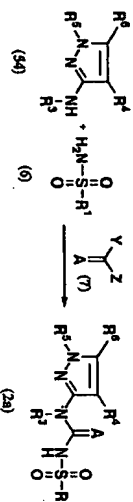


(H) 本発明化合物(2a)は、化合物(54)と1~5当量の化合物(5)とを塩基の存在下取いは非存在下、通常用いられる溶媒中、冷却下、室温または加熱下反応させることにより得ることができる。
[化61]

[式中、A、R¹、R³、R⁴、R⁵、R⁶は前記と同様である。]

本反応において使用される塩基および溶媒としては前記(B)で述べたものと同様のものが挙げられる。

(1) 本発明化合物(2a)と1~5当



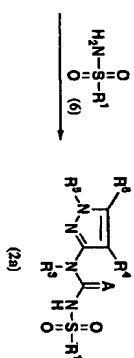
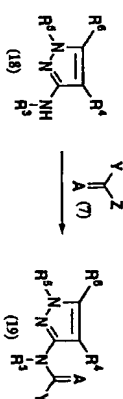
量の化合物(6)とを適当な塩基および(7)の存在下、不活性溶媒中、冷却下、室温または加熱下、反応させることにより得ることができる。
[化62]

[式中、Y、Z、A、R¹、R³、R⁴、R⁵、R⁶は前記と同様である。]

本反応において使用される塩基および溶媒としては前記(B)で述べたものと同様のものが挙げられる。

[0018] (J) 本発明化合物(2a)は、化合物(18)と1~5当量の化合物(7)とを適当な塩基の存在

下、不活性溶媒中、冷却下、室温または加熱下反応させることにより得ることができる。これを1~5当量の化合物(6)と適当な塩基の存在下、不活性溶媒中、冷却下、室温または加熱下反応させることにより、得ることができる。
[化63]



[式中、Y、Z、A、R¹、R³、R⁴、R⁵、R⁶は前記と同様である。]

本反応において使用される塩基および溶媒としては前記(B)で述べたものと同様のものが挙げられる。

(K) 本発明化合物(2a)は、化合物(6)と1~5当量の化合物(7)とを適当な塩基の存在下、不活性溶媒中、冷却下、室温または加熱下反応させることにより得ることができる。これを1~5当量の化合物(6)と適当な塩基の存在下、不活性溶媒中、冷却下、室温または加熱下反応させることにより得ることができる。
[化64]

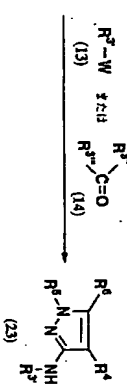
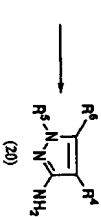
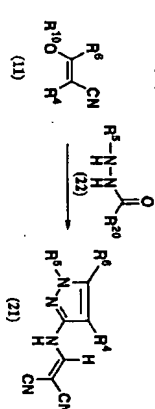
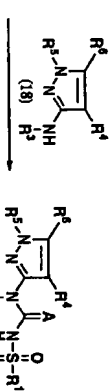
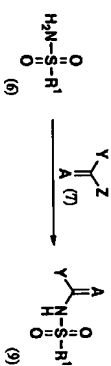


表 2

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
0	Cyclohexyl-	-H	-H	-H	Ph-	Me-
0	Cyclohexyl-	-H	-H	-H	Ph-	Et-
0	Cyclohexyl-	-H	-H	-H	Ph-	ⁿ Pr-
0	Cyclohexyl-	-H	-H	-H	Ph-	ⁱ Pr-
0	Cyclohexyl-	-H	-H	-H	Ph-	^t Bu-
0	Cyclohexyl-	-H	-H	-H	Ph-	ⁱ Bu-
0	Cyclohexyl-	-H	-H	-H	Ph-	CF ₃ -
0	Cyclohexyl-	-H	-H	-H	Ph-	Cyclopentyl-
0	Cyclohexyl-	-H	-H	-H	Ph-	Cyclohexyl-
0	Cyclohexyl-	-H	-H	-H	Ph-	Ph-
0	Cyclohexyl-	-H	-H	-H	Ph-	2-Pyridyl-
0	Cyclohexyl-	-H	-H	-H	Ph-	3-Pyridyl-
0	Cyclohexyl-	-H	-H	-H	Ph-	4-Pyridyl-
0	Cyclohexyl-	-H	-H	-H	Ph-	2-Furyl-
0	Cyclohexyl-	-H	-H	-H	Ph-	3-Furyl-
0	Cyclohexyl-	-H	-H	-H	Ph-	2-Thienyl-
0	Cyclohexyl-	-H	-H	-H	Ph-	3-Thienyl-
0	Cyclohexyl-	-H	-H	-H	Ph-	CH ₂ CN
0	Cyclohexyl-	-H	-H	-H	Ph-	CH ₂ CO ₂ Et
0	Cyclohexyl-	-H	-H	-H	Ph-	CH ₂ CO ₂ H
0	Cyclohexyl-	-H	-H	-H	Ph-	(CH ₂) ₂ OH
0	Cyclohexyl-	-H	-H	-H	Ph-	(CH ₂) ₂ OMe
0	Cyclohexyl-	-H	-H	-H	Ph-	(CH ₂) ₂ NMe ₂

【表3】

表 3

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
0	Ph-	-H	-H	-H	Ph-	Me-
0	Ph-	-H	-H	-H	Ph-	Et-
0	Ph-	-H	-H	-H	Ph-	ⁿ Pr-
0	Ph-	-H	-H	-H	Ph-	ⁱ Pr-
0	Ph-	-H	-H	-H	Ph-	^t Bu-
0	Ph-	-H	-H	-H	Ph-	ⁱ Bu-
0	Ph-	-H	-H	-H	Ph-	CF ₃ -
0	Ph-	-H	-H	-H	Ph-	Cyclopentyl-
0	Ph-	-H	-H	-H	Ph-	Cyclohexyl-
0	Ph-	-H	-H	-H	Ph-	Ph-
0	Ph-	-H	-H	-H	Ph-	2-Pyridyl-
0	Ph-	-H	-H	-H	Ph-	3-Pyridyl-
0	Ph-	-H	-H	-H	Ph-	4-Pyridyl-
0	Ph-	-H	-H	-H	Ph-	2-Furyl-
0	Ph-	-H	-H	-H	Ph-	3-Furyl-
0	Ph-	-H	-H	-H	Ph-	2-Thienyl-
0	Ph-	-H	-H	-H	Ph-	3-Thienyl-
0	Ph-	-H	-H	-H	Ph-	CH ₂ CN
0	Ph-	-H	-H	-H	Ph-	CH ₂ CO ₂ Et
0	Ph-	-H	-H	-H	Ph-	CH ₂ CO ₂ H
0	Ph-	-H	-H	-H	Ph-	(CH ₂) ₂ OH
0	Ph-	-H	-H	-H	Ph-	(CH ₂) ₂ OMe
0	Ph-	-H	-H	-H	Ph-	(CH ₂) ₂ NMe ₂

【表4】

表 4

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
0	2-Me-Ph	-H	-H	-H	Ph	Me
0	2-Me-Ph	-H	-H	-H	Ph	Et
0	2-Me-Ph	-H	-H	-H	Ph	ⁿ Pr
0	2-Me-Ph	-H	-H	-H	Ph	^{is} Pr
0	2-Me-Ph	-H	-H	-H	Ph	^t Bu
0	2-Me-Ph	-H	-H	-H	Ph	^t Bu
0	2-Me-Ph	-H	-H	-H	Ph	CF ₃
0	2-Me-Ph	-H	-H	-H	Ph	Cyclopentyl
0	2-Me-Ph	-H	-H	-H	Ph	Cyclohexyl
0	2-Me-Ph	-H	-H	-H	Ph	Ph
0	2-Me-Ph	-H	-H	-H	Ph	2-Pyridyl
0	2-Me-Ph	-H	-H	-H	Ph	3-Pyridyl
0	2-Me-Ph	-H	-H	-H	Ph	4-Pyridyl
0	2-Me-Ph	-H	-H	-H	Ph	2-Furyl
0	2-Me-Ph	-H	-H	-H	Ph	3-Furyl
0	2-Me-Ph	-H	-H	-H	Ph	2-Thienyl
0	2-Me-Ph	-H	-H	-H	Ph	3-Thienyl
0	2-Me-Ph	-H	-H	-H	Ph	CH ₃ CN
0	2-Me-Ph	-H	-H	-H	Ph	CH ₃ CO ₂ Et
0	2-Me-Ph	-H	-H	-H	Ph	CH ₃ CO ₂ H
0	2-Me-Ph	-H	-H	-H	Ph	(CH ₃) ₂ OH
0	2-Me-Ph	-H	-H	-H	Ph	(CH ₃) ₂ OMe
0	2-Me-Ph	-H	-H	-H	Ph	(CH ₃) ₂ NMe ₂

【表5】

表 5

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
0	3-Me-Ph	-H	-H	-H	Ph	Me
0	3-Me-Ph	-H	-H	-H	Ph	Et
0	3-Me-Ph	-H	-H	-H	Ph	ⁿ Pr
0	3-Me-Ph	-H	-H	-H	Ph	^{is} Pr
0	3-Me-Ph	-H	-H	-H	Ph	^t Bu
0	3-Me-Ph	-H	-H	-H	Ph	^t Bu
0	3-Me-Ph	-H	-H	-H	Ph	CF ₃
0	3-Me-Ph	-H	-H	-H	Ph	Cyclopentyl
0	3-Me-Ph	-H	-H	-H	Ph	Cyclohexyl
0	3-Me-Ph	-H	-H	-H	Ph	Ph
0	3-Me-Ph	-H	-H	-H	Ph	2-Pyridyl
0	3-Me-Ph	-H	-H	-H	Ph	3-Pyridyl
0	3-Me-Ph	-H	-H	-H	Ph	4-Pyridyl
0	3-Me-Ph	-H	-H	-H	Ph	2-Furyl
0	3-Me-Ph	-H	-H	-H	Ph	3-Furyl
0	3-Me-Ph	-H	-H	-H	Ph	2-Thienyl
0	3-Me-Ph	-H	-H	-H	Ph	3-Thienyl
0	3-Me-Ph	-H	-H	-H	Ph	CH ₃ CN
0	3-Me-Ph	-H	-H	-H	Ph	CH ₃ CO ₂ Et
0	3-Me-Ph	-H	-H	-H	Ph	CH ₃ CO ₂ H
0	3-Me-Ph	-H	-H	-H	Ph	(CH ₃) ₂ OH
0	3-Me-Ph	-H	-H	-H	Ph	(CH ₃) ₂ OMe
0	3-Me-Ph	-H	-H	-H	Ph	(CH ₃) ₂ NMe ₂

【0023】

【表6】

表 8

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
0	4-Pr-Ph	H	H	H	Ph	Me
0	4-Pr-Ph	H	H	H	Ph	Et
0	4-Pr-Ph	H	H	H	Ph	ⁿ Pr
0	4-Pr-Ph	H	H	H	Ph	ⁱ Pr
0	4-Pr-Ph	H	H	H	Ph	ⁿ Bu
0	4-Pr-Ph	H	H	H	Ph	ⁱ Bu
0	4-Pr-Ph	H	H	H	Ph	Cyclopentyl
0	4-Pr-Ph	H	H	H	Ph	Cyclohexyl
0	4-Pr-Ph	H	H	H	Ph	Ph
0	4-Pr-Ph	H	H	H	Ph	2-Pyridyl
0	4-Pr-Ph	H	H	H	Ph	3-Pyridyl
0	4-Pr-Ph	H	H	H	Ph	4-Pyridyl
0	4-Pr-Ph	H	H	H	Ph	2-Furyl
0	4-Pr-Ph	H	H	H	Ph	3-Furyl
0	4-Pr-Ph	H	H	H	Ph	2-Thienyl
0	4-Pr-Ph	H	H	H	Ph	3-Thienyl
0	4-Pr-Ph	H	H	H	Ph	CH ₂ CN
0	4-Pr-Ph	H	H	H	Ph	CH ₂ CO ₂ Et
0	4-Pr-Ph	H	H	H	Ph	CH ₂ CO ₂ H
0	4-Pr-Ph	H	H	H	Ph	(CH ₂) ₂ OH
0	4-Pr-Ph	H	H	H	Ph	(CH ₂) ₂ OMe
0	4-Pr-Ph	H	H	H	Ph	(CH ₂) ₂ NMe ₂

【表9】

表 9

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
0	4-Pr-Ph	H	H	H	Ph	Me
0	4-Pr-Ph	H	H	H	Ph	Et
0	4-Pr-Ph	H	H	H	Ph	ⁿ Pr
0	4-Pr-Ph	H	H	H	Ph	ⁱ Pr
0	4-Pr-Ph	H	H	H	Ph	ⁿ Bu
0	4-Pr-Ph	H	H	H	Ph	ⁱ Bu
0	4-Pr-Ph	H	H	H	Ph	Cyclopentyl
0	4-Pr-Ph	H	H	H	Ph	Cyclohexyl
0	4-Pr-Ph	H	H	H	Ph	Ph
0	4-Pr-Ph	H	H	H	Ph	2-Pyridyl
0	4-Pr-Ph	H	H	H	Ph	3-Pyridyl
0	4-Pr-Ph	H	H	H	Ph	4-Pyridyl
0	4-Pr-Ph	H	H	H	Ph	2-Furyl
0	4-Pr-Ph	H	H	H	Ph	3-Furyl
0	4-Pr-Ph	H	H	H	Ph	2-Thienyl
0	4-Pr-Ph	H	H	H	Ph	3-Thienyl
0	4-Pr-Ph	H	H	H	Ph	CH ₂ CN
0	4-Pr-Ph	H	H	H	Ph	CH ₂ CO ₂ Et
0	4-Pr-Ph	H	H	H	Ph	CH ₂ CO ₂ H
0	4-Pr-Ph	H	H	H	Ph	(CH ₂) ₂ OH
0	4-Pr-Ph	H	H	H	Ph	(CH ₂) ₂ OMe
0	4-Pr-Ph	H	H	H	Ph	(CH ₂) ₂ NMe ₂

【表10】

表 10

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
0	2- ⁿ Bu-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	Me-
0	2- ⁿ Bu-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	Et-
0	2- ⁿ Bu-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	ⁿ Pr-
0	2- ⁿ Bu-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	ⁱ Pr-
0	2- ⁿ Bu-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	ⁿ Bu-
0	2- ⁿ Bu-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	ⁿ Bu-
0	2- ⁿ Bu-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	Cyclohexyl-
0	2- ⁿ Bu-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	Cyclohexyl-
0	2- ⁿ Bu-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	Ph-
0	2- ⁿ Bu-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	2-Pyridyl-
0	2- ⁿ Bu-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	3-Pyridyl-
0	2- ⁿ Bu-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	4-Pyridyl-
0	2- ⁿ Bu-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	2-Furyl-
0	2- ⁿ Bu-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	3-Furyl-
0	2- ⁿ Bu-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	2-Thienyl-
0	2- ⁿ Bu-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	3-Thienyl-
0	2- ⁿ Bu-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	-CH ₂ CN
0	2- ⁿ Bu-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	-CH ₂ CO ₂ Et
0	2- ⁿ Bu-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	-CH ₂ CO ₂ H
0	2- ⁿ Bu-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	-(CH ₂) ₂ OH
0	2- ⁿ Bu-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	-(CH ₂) ₂ OMe
0	2- ⁿ Bu-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	-(CH ₂) ₂ NMe ₂

【0024】

【表 11】

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
0	3- ⁿ Bu-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	Me-
0	3- ⁿ Bu-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	Et-
0	3- ⁿ Bu-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	ⁿ Pr-
0	3- ⁿ Bu-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	ⁱ Pr-
0	3- ⁿ Bu-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	ⁿ Bu-
0	3- ⁿ Bu-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	ⁿ Bu-
0	3- ⁿ Bu-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	Cyclohexyl-
0	3- ⁿ Bu-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	Cyclohexyl-
0	3- ⁿ Bu-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	Ph-
0	3- ⁿ Bu-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	2-Pyridyl-
0	3- ⁿ Bu-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	3-Pyridyl-
0	3- ⁿ Bu-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	4-Pyridyl-
0	3- ⁿ Bu-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	2-Furyl-
0	3- ⁿ Bu-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	3-Furyl-
0	3- ⁿ Bu-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	2-Thienyl-
0	3- ⁿ Bu-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	3-Thienyl-
0	3- ⁿ Bu-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	-CH ₂ CN
0	3- ⁿ Bu-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	-CH ₂ CO ₂ Et
0	3- ⁿ Bu-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	-CH ₂ CO ₂ H
0	3- ⁿ Bu-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	-(CH ₂) ₂ OH
0	3- ⁿ Bu-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	-(CH ₂) ₂ OMe
0	3- ⁿ Bu-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	-(CH ₂) ₂ NMe ₂

【表 12】

表 11

表 12

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
0	4-Bu-Ph-	H	H	H	Ph-	Me-
0	4-Bu-Ph-	H	H	H	Ph-	Et-
0	4-Bu-Ph-	H	H	H	Ph-	ⁿ Pr-
0	4-Bu-Ph-	H	H	H	Ph-	ⁱ Pr-
0	4-Bu-Ph-	H	H	H	Ph-	ⁿ Bu-
0	4-Bu-Ph-	H	H	H	Ph-	ⁱ Bu-
0	4-Bu-Ph-	H	H	H	Ph-	Cyclopentyl-
0	4-Bu-Ph-	H	H	H	Ph-	Cyclohexyl-
0	4-Bu-Ph-	H	H	H	Ph-	Ph-
0	4-Bu-Ph-	H	H	H	Ph-	2-Pyridyl-
0	4-Bu-Ph-	H	H	H	Ph-	3-Pyridyl-
0	4-Bu-Ph-	H	H	H	Ph-	4-Pyridyl-
0	4-Bu-Ph-	H	H	H	Ph-	2-Furyl-
0	4-Bu-Ph-	H	H	H	Ph-	3-Furyl-
0	4-Bu-Ph-	H	H	H	Ph-	2-Thienyl-
0	4-Bu-Ph-	H	H	H	Ph-	3-Thienyl-
0	4-Bu-Ph-	H	H	H	Ph-	-CH ₂ CN
0	4-Bu-Ph-	H	H	H	Ph-	-CH ₂ CO ₂ Et
0	4-Bu-Ph-	H	H	H	Ph-	-CH ₂ CO ₂ H
0	4-Bu-Ph-	H	H	H	Ph-	-(CH ₂) ₂ OH
0	4-Bu-Ph-	H	H	H	Ph-	-(CH ₂) ₂ OMe
0	4-Bu-Ph-	H	H	H	Ph-	-(CH ₂) ₂ NMe ₂

【表 13】

表 13

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
0	4-Bu-Ph-	H	H	H	Ph-	Me-
0	4-Bu-Ph-	H	H	H	Ph-	Et-
0	4-Bu-Ph-	H	H	H	Ph-	ⁿ Pr-
0	4-Bu-Ph-	H	H	H	Ph-	ⁱ Pr-
0	4-Bu-Ph-	H	H	H	Ph-	ⁿ Bu-
0	4-Bu-Ph-	H	H	H	Ph-	ⁱ Bu-
0	4-Bu-Ph-	H	H	H	Ph-	Cyclopentyl-
0	4-Bu-Ph-	H	H	H	Ph-	Cyclohexyl-
0	4-Bu-Ph-	H	H	H	Ph-	Ph-
0	4-Bu-Ph-	H	H	H	Ph-	2-Pyridyl-
0	4-Bu-Ph-	H	H	H	Ph-	3-Pyridyl-
0	4-Bu-Ph-	H	H	H	Ph-	4-Pyridyl-
0	4-Bu-Ph-	H	H	H	Ph-	2-Furyl-
0	4-Bu-Ph-	H	H	H	Ph-	3-Furyl-
0	4-Bu-Ph-	H	H	H	Ph-	2-Thienyl-
0	4-Bu-Ph-	H	H	H	Ph-	3-Thienyl-
0	4-Bu-Ph-	H	H	H	Ph-	-CH ₂ CN
0	4-Bu-Ph-	H	H	H	Ph-	-CH ₂ CO ₂ Et
0	4-Bu-Ph-	H	H	H	Ph-	-CH ₂ CO ₂ H
0	4-Bu-Ph-	H	H	H	Ph-	-(CH ₂) ₂ OH
0	4-Bu-Ph-	H	H	H	Ph-	-(CH ₂) ₂ OMe
0	4-Bu-Ph-	H	H	H	Ph-	-(CH ₂) ₂ NMe ₂

【表 14】

表 14

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
0	2-Cl-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	Me-
0	2-Cl-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	Et-
0	2-Cl-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	ⁿ Pr-
0	2-Cl-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	ⁱ Pr-
0	2-Cl-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	ⁿ Bu-
0	2-Cl-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	^t Bu-
0	2-Cl-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	CF ₃
0	2-Cl-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	Cyclopropyl-
0	2-Cl-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	Cyclohexyl-
0	2-Cl-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	Ph-
0	2-Cl-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	2-Pyridyl-
0	2-Cl-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	3-Pyridyl-
0	2-Cl-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	4-Pyridyl-
0	2-Cl-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	2-Furyl-
0	2-Cl-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	3-Furyl-
0	2-Cl-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	2-Thienyl-
0	2-Cl-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	3-Thienyl-
0	2-Cl-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	-CH ₂ CN
0	2-Cl-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	-CH ₂ CO ₂ Et
0	2-Cl-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	-CH ₂ CO ₂ H
0	2-Cl-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	-(CH ₂) ₂ OH
0	2-Cl-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	-(CH ₂) ₂ OMe
0	2-Cl-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	-(CH ₂) ₂ NMe ₂

【表15】

表 16

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
0	3-Cl-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	Me-
0	3-Cl-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	Et-
0	3-Cl-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	ⁿ Pr-
0	3-Cl-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	ⁱ Pr-
0	3-Cl-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	ⁿ Bu-
0	3-Cl-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	^t Bu-
0	3-Cl-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	Cyclopropyl-
0	3-Cl-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	Cyclohexyl-
0	3-Cl-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	Ph-
0	3-Cl-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	2-Pyridyl-
0	3-Cl-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	3-Pyridyl-
0	3-Cl-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	4-Pyridyl-
0	3-Cl-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	2-Furyl-
0	3-Cl-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	3-Furyl-
0	3-Cl-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	2-Thienyl-
0	3-Cl-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	3-Thienyl-
0	3-Cl-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	-CH ₂ CN
0	3-Cl-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	-CH ₂ CO ₂ Et
0	3-Cl-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	-CH ₂ CO ₂ H
0	3-Cl-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	-(CH ₂) ₂ OH
0	3-Cl-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	-(CH ₂) ₂ OMe
0	3-Cl-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	-(CH ₂) ₂ NMe ₂

【表16】

表 16

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
0	4-O-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	Me-
0	4-O-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	Et-
0	4-O-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	ⁱ Pr-
0	4-O-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	ⁿ Pr-
0	4-O-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	^t Bu-
0	4-O-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	ⁱ Bu-
0	4-O-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	CS ₂ -
0	4-O-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	Cyclohexyl-
0	4-O-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	Cyclohexyl-
0	4-O-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	Ph-
0	4-O-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	2-Pyridyl-
0	4-O-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	3-Pyridyl-
0	4-O-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	4-Pyridyl-
0	4-O-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	2-Furyl-
0	4-O-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	2-Furyl-
0	4-O-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	3-Furyl-
0	4-O-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	2-Thienyl-
0	4-O-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	3-Thienyl-
0	4-O-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	-CH ₂ CN
0	4-O-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	-CH ₂ CO ₂ Et
0	4-O-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	-CH ₂ CO ₂ H
0	4-O-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	-(CH ₂) ₂ OH
0	4-O-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	-(CH ₂) ₂ OMe
0	4-O-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	-(CH ₂) ₂ NMe ₂

【表17】

表 17

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
0	4-B-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	Me-
0	4-B-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	Et-
0	4-B-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	ⁿ Pr-
0	4-B-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	ⁱ Pr-
0	4-B-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	^t Bu-
0	4-B-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	ⁱ Bu-
0	4-B-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	Cyclohexyl-
0	4-B-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	Cyclohexyl-
0	4-B-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	Ph-
0	4-B-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	2-Pyridyl-
0	4-B-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	3-Pyridyl-
0	4-B-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	4-Pyridyl-
0	4-B-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	2-Furyl-
0	4-B-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	2-Furyl-
0	4-B-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	3-Furyl-
0	4-B-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	2-Thienyl-
0	4-B-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	3-Thienyl-
0	4-B-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	-CH ₂ CN
0	4-B-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	-CH ₂ CO ₂ Et
0	4-B-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	-CH ₂ CO ₂ H
0	4-B-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	-(CH ₂) ₂ OH
0	4-B-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	-(CH ₂) ₂ OMe
0	4-B-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	-(CH ₂) ₂ NMe ₂

【表18】

表 18

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
0	4-F-Ph-	H	H	H	Ph-	Me-
0	4-F-Ph-	H	H	H	Ph-	Et-
0	4-F-Ph-	H	H	H	Ph-	ⁿ Pr-
0	4-F-Ph-	H	H	H	Ph-	ⁱ Pr-
0	4-F-Ph-	H	H	H	Ph-	^t Bu-
0	4-F-Ph-	H	H	H	Ph-	Bu-
0	4-F-Ph-	H	H	H	Ph-	Cyclopentyl-
0	4-F-Ph-	H	H	H	Ph-	Cyclohexyl-
0	4-F-Ph-	H	H	H	Ph-	Ph-
0	4-F-Ph-	H	H	H	Ph-	2-Pyridyl-
0	4-F-Ph-	H	H	H	Ph-	3-Pyridyl-
0	4-F-Ph-	H	H	H	Ph-	4-Pyridyl-
0	4-F-Ph-	H	H	H	Ph-	2-Furyl-
0	4-F-Ph-	H	H	H	Ph-	3-Furyl-
0	4-F-Ph-	H	H	H	Ph-	2-Thienyl-
0	4-F-Ph-	H	H	H	Ph-	3-Thienyl-
0	4-F-Ph-	H	H	H	Ph-	-CH ₂ CN
0	4-F-Ph-	H	H	H	Ph-	-CH ₂ CO ₂ Et
0	4-F-Ph-	H	H	H	Ph-	-CH ₂ CO ₂ H
0	4-F-Ph-	H	H	H	Ph-	-(CH ₂) ₂ OH
0	4-F-Ph-	H	H	H	Ph-	-(CH ₂) ₂ OMe
0	4-F-Ph-	H	H	H	Ph-	-(CH ₂) ₂ NMe ₂

【表19】

表 19

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
0	4-I-Ph-	H	H	H	Ph-	Me-
0	4-I-Ph-	H	H	H	Ph-	Et-
0	4-I-Ph-	H	H	H	Ph-	ⁿ Pr-
0	4-I-Ph-	H	H	H	Ph-	ⁱ Pr-
0	4-I-Ph-	H	H	H	Ph-	^t Bu-
0	4-I-Ph-	H	H	H	Ph-	Bu-
0	4-I-Ph-	H	H	H	Ph-	Cyclopentyl-
0	4-I-Ph-	H	H	H	Ph-	Cyclohexyl-
0	4-I-Ph-	H	H	H	Ph-	Ph-
0	4-I-Ph-	H	H	H	Ph-	2-Pyridyl-
0	4-I-Ph-	H	H	H	Ph-	3-Pyridyl-
0	4-I-Ph-	H	H	H	Ph-	4-Pyridyl-
0	4-I-Ph-	H	H	H	Ph-	2-Furyl-
0	4-I-Ph-	H	H	H	Ph-	3-Furyl-
0	4-I-Ph-	H	H	H	Ph-	2-Thienyl-
0	4-I-Ph-	H	H	H	Ph-	3-Thienyl-
0	4-I-Ph-	H	H	H	Ph-	-CH ₂ CN
0	4-I-Ph-	H	H	H	Ph-	-CH ₂ CO ₂ Et
0	4-I-Ph-	H	H	H	Ph-	-CH ₂ CO ₂ H
0	4-I-Ph-	H	H	H	Ph-	-(CH ₂) ₂ OH
0	4-I-Ph-	H	H	H	Ph-	-(CH ₂) ₂ OMe
0	4-I-Ph-	H	H	H	Ph-	-(CH ₂) ₂ NMe ₂

【表20】

20

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
0	1-Naphthyl-	-H	-H	-H	Ph-	Me-
0	1-Naphthyl-	-H	-H	-H	Ph-	Et-
0	1-Naphthyl-	-H	-H	-H	Ph-	Pr-
0	1-Naphthyl-	-H	-H	-H	Ph-	Isop-
0	1-Naphthyl-	-H	-H	-H	Ph-	But-
0	1-Naphthyl-	-H	-H	-H	Ph-	Isobut-
0	1-Naphthyl-	-H	-H	-H	Ph-	Cyclohexyl-
0	1-Naphthyl-	-H	-H	-H	Ph-	Cyclohexyl-
0	1-Naphthyl-	-H	-H	-H	Ph-	Oxalonyl-
0	1-Naphthyl-	-H	-H	-H	Ph-	Ph-
0	1-Naphthyl-	-H	-H	-H	Ph-	2-Pyridyl-
0	1-Naphthyl-	-H	-H	-H	Ph-	3-Pyridyl-
0	1-Naphthyl-	-H	-H	-H	Ph-	2-Furyl-
0	1-Naphthyl-	-H	-H	-H	Ph-	4-Pyridyl-
0	1-Naphthyl-	-H	-H	-H	Ph-	3-Furyl-
0	1-Naphthyl-	-H	-H	-H	Ph-	2-Thienyl-
0	1-Naphthyl-	-H	-H	-H	Ph-	3-Thienyl-
0	1-Naphthyl-	-H	-H	-H	Ph-	3-Thienyl-
0	1-Naphthyl-	-H	-H	-H	Ph-	CH ₃ CO ₂ Et
0	1-Naphthyl-	-H	-H	-H	Ph-	CH ₃ CO ₂ H
0	1-Naphthyl-	-H	-H	-H	Ph-	(CH ₃) ₂ SOH
0	1-Naphthyl-	-H	-H	-H	Ph-	(CH ₃) ₂ OMe
0	1-Naphthyl-	-H	-H	-H	Ph-	(CH ₃) ₂ NMe ₂

[0025]

【表21】

【喪22】

表 21

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
0	2-Naphthyl-	-H	-H	-H	Ph-	Me-
0	2-Naphthyl-	-H	-H	-H	Ph-	Et-
0	2-Naphthyl-	-H	-H	-H	Ph-	Pr-
0	2-Naphthyl-	-H	-H	-H	Ph-	Bu-
0	2-Naphthyl-	-H	-H	-H	Ph-	Bu-
0	2-Naphthyl-	-H	-H	-H	Ph-	Cyclohexyl-
0	2-Naphthyl-	-H	-H	-H	Ph-	Cyclohexyl- Oxaloxyl-
0	2-Naphthyl-	-H	-H	-H	Ph-	Ph-
0	2-Naphthyl-	-H	-H	-H	Ph-	2-Pyridyl-
0	2-Naphthyl-	-H	-H	-H	Ph-	3-Pyridyl-
0	2-Naphthyl-	-H	-H	-H	Ph-	4-Pyridyl-
0	2-Naphthyl-	-H	-H	-H	Ph-	2-Furyl-
0	2-Naphthyl-	-H	-H	-H	Ph-	3-Furyl-
0	2-Naphthyl-	-H	-H	-H	Ph-	3-Thienyl-
0	2-Naphthyl-	-H	-H	-H	Ph-	3-Thienyl-
0	2-Naphthyl-	-H	-H	-H	Ph-	CH ₃ CO ₂ Et
0	2-Naphthyl-	-H	-H	-H	Ph-	CH ₃ CO ₂ H
0	2-Naphthyl-	-H	-H	-H	Ph-	(CH ₃) ₂ OH
0	2-Naphthyl-	-H	-H	-H	Ph-	(CH ₃) ₂ ONe
0	2-Naphthyl-	-H	-H	-H	Ph-	(CH ₃) ₂ NMe ₂

表 22

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
0	4-MeODC-Ph	-H	-H	-H	Ph-	Me-
0	4-MeODC-Ph	-H	-H	-H	Ph-	Et-
0	4-MeODC-Ph	-H	-H	-H	Ph-	ⁱ Pr-
0	4-MeODC-Ph	-H	-H	-H	Ph-	ⁿ Pr-
0	4-MeODC-Ph	-H	-H	-H	Ph-	Bu-
0	4-MeODC-Ph	-H	-H	-H	Ph-	Bu-
0	4-MeODC-Ph	-H	-H	-H	Ph-	Cyclopentyl-
0	4-MeODC-Ph	-H	-H	-H	Ph-	Cyclohexyl-
0	4-MeODC-Ph	-H	-H	-H	Ph-	Ph-
0	4-MeODC-Ph	-H	-H	-H	Ph-	2-Pyridyl-
0	4-MeODC-Ph	-H	-H	-H	Ph-	3-Pyridyl-
0	4-MeODC-Ph	-H	-H	-H	Ph-	4-Pyridyl-
0	4-MeODC-Ph	-H	-H	-H	Ph-	4-Pyridyl-
0	4-MeODC-Ph	-H	-H	-H	Ph-	2-Furyl-
0	4-MeODC-Ph	-H	-H	-H	Ph-	3-Furyl-
0	4-MeODC-Ph	-H	-H	-H	Ph-	2-Thienyl-
0	4-MeODC-Ph	-H	-H	-H	Ph-	3-Thienyl-
0	4-MeODC-Ph	-H	-H	-H	Ph-	-CH ₂ CN
0	4-MeODC-Ph	-H	-H	-H	Ph-	-CH ₂ CO ₂ Et
0	4-MeODC-Ph	-H	-H	-H	Ph-	-CH ₂ CO ₂ H
0	4-MeODC-Ph	-H	-H	-H	Ph-	-CH ₂ CO ₂ H
0	4-MeODC-Ph	-H	-H	-H	Ph-	-(CH ₂) ₂ OMe
0	4-MeODC-Ph	-H	-H	-H	Ph-	-(CH ₂) ₂ NMe ₂

【表23】

表 23

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
0	4-HO-Ph	-H	-H	-H	Ph-	Me-
0	4-HO-Ph	-H	-H	-H	Ph-	Et-
0	4-HO-Ph	-H	-H	-H	Ph-	ⁱ Pr-
0	4-HO-Ph	-H	-H	-H	Ph-	ⁿ Pr-
0	4-HO-Ph	-H	-H	-H	Ph-	Bu-
0	4-HO-Ph	-H	-H	-H	Ph-	Bu-
0	4-HO-Ph	-H	-H	-H	Ph-	Cyclopentyl-
0	4-HO-Ph	-H	-H	-H	Ph-	Cyclohexyl-
0	4-HO-Ph	-H	-H	-H	Ph-	Ph-
0	4-HO-Ph	-H	-H	-H	Ph-	2-Pyridyl-
0	4-HO-Ph	-H	-H	-H	Ph-	3-Pyridyl-
0	4-HO-Ph	-H	-H	-H	Ph-	4-Pyridyl-
0	4-HO-Ph	-H	-H	-H	Ph-	4-Pyridyl-
0	4-HO-Ph	-H	-H	-H	Ph-	2-Furyl-
0	4-HO-Ph	-H	-H	-H	Ph-	3-Furyl-
0	4-HO-Ph	-H	-H	-H	Ph-	2-Thienyl-
0	4-HO-Ph	-H	-H	-H	Ph-	3-Thienyl-
0	4-HO-Ph	-H	-H	-H	Ph-	-CH ₂ CN
0	4-HO-Ph	-H	-H	-H	Ph-	-CH ₂ CO ₂ Et
0	4-HO-Ph	-H	-H	-H	Ph-	-CH ₂ CO ₂ H
0	4-HO-Ph	-H	-H	-H	Ph-	-(CH ₂) ₂ OMe
0	4-HO-Ph	-H	-H	-H	Ph-	-(CH ₂) ₂ OMe
0	4-HO-Ph	-H	-H	-H	Ph-	-(CH ₂) ₂ NMe ₂

【表24】

表 24

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
0	4-HOOC-Ph	H	H	H	Ph	Me
0	4-HOOC-Ph	H	H	H	Ph	Et
0	4-HOOC-Ph	H	H	H	Ph	ⁿ Pr
0	4-HOOC-Ph	H	H	H	Ph	ⁱ Pr
0	4-HOOC-Ph	H	H	H	Ph	^t Bu
0	4-HOOC-Ph	H	H	H	Ph	ⁿ Bu
0	4-HOOC-Ph	H	H	H	Ph	Cyclopentyl
0	4-HOOC-Ph	H	H	H	Ph	Cyclohexyl
0	4-HOOC-Ph	H	H	H	Ph	Ph
0	4-HOOC-Ph	H	H	H	Ph	2-Pyridyl
0	4-HOOC-Ph	H	H	H	Ph	3-Pyridyl
0	4-HOOC-Ph	H	H	H	Ph	4-Pyridyl
0	4-HOOC-Ph	H	H	H	Ph	2-Furyl
0	4-HOOC-Ph	H	H	H	Ph	3-Furyl
0	4-HOOC-Ph	H	H	H	Ph	2-Thienyl
0	4-HOOC-Ph	H	H	H	Ph	3-Thienyl
0	4-HOOC-Ph	H	H	H	Ph	CH ₂ CN
0	4-HOOC-Ph	H	H	H	Ph	CH ₂ CO ₂ Et
0	4-HOOC-Ph	H	H	H	Ph	CH ₂ CO ₂ H
0	4-HOOC-Ph	H	H	H	Ph	(CH ₂) ₂ OH
0	4-HOOC-Ph	H	H	H	Ph	(CH ₂) ₂ OMe
0	4-HOOC-Ph	H	H	H	Ph	(CH ₂) ₂ NMe ₂

【表 2 5】

表 25

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
0	4-MeO-Ph	H	H	H	Ph	Me
0	4-MeO-Ph	H	H	H	Ph	Et
0	4-MeO-Ph	H	H	H	Ph	ⁿ Pr
0	4-MeO-Ph	H	H	H	Ph	ⁱ Pr
0	4-MeO-Ph	H	H	H	Ph	^t Bu
0	4-MeO-Ph	H	H	H	Ph	ⁿ Bu
0	4-MeO-Ph	H	H	H	Ph	Cyclopentyl
0	4-MeO-Ph	H	H	H	Ph	Cyclohexyl
0	4-MeO-Ph	H	H	H	Ph	Ph
0	4-MeO-Ph	H	H	H	Ph	2-Pyridyl
0	4-MeO-Ph	H	H	H	Ph	3-Pyridyl
0	4-MeO-Ph	H	H	H	Ph	4-Pyridyl
0	4-MeO-Ph	H	H	H	Ph	2-Furyl
0	4-MeO-Ph	H	H	H	Ph	3-Furyl
0	4-MeO-Ph	H	H	H	Ph	2-Thienyl
0	4-MeO-Ph	H	H	H	Ph	3-Thienyl
0	4-MeO-Ph	H	H	H	Ph	CH ₂ CN
0	4-MeO-Ph	H	H	H	Ph	CH ₂ CO ₂ Et
0	4-MeO-Ph	H	H	H	Ph	CH ₂ CO ₂ H
0	4-MeO-Ph	H	H	H	Ph	(CH ₂) ₂ OH
0	4-MeO-Ph	H	H	H	Ph	(CH ₂) ₂ OMe
0	4-MeO-Ph	H	H	H	Ph	(CH ₂) ₂ NMe ₂

【表 2 6】

表 26

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
0	4-HOCH ₂ -Ph	H	H	H	Ph	Me-
0	4-HOCH ₂ -Ph	H	H	H	Ph	Et-
0	4-HOCH ₂ -Ph	H	H	H	Ph	ⁿ Pr-
0	4-HOCH ₂ -Ph	H	H	H	Ph	ⁱ Pr-
0	4-HOCH ₂ -Ph	H	H	H	Ph	ⁿ Bu-
0	4-HOCH ₂ -Ph	H	H	H	Ph	ⁱ Bu-
0	4-HOCH ₂ -Ph	H	H	H	Ph	Cyclopentyl-
0	4-HOCH ₂ -Ph	H	H	H	Ph	Cyclohexyl-
0	4-HOCH ₂ -Ph	H	H	H	Ph	Ph-
0	4-HOCH ₂ -Ph	H	H	H	Ph	2-Pyridyl-
0	4-HOCH ₂ -Ph	H	H	H	Ph	3-Pyridyl-
0	4-HOCH ₂ -Ph	H	H	H	Ph	4-Pyridyl-
0	4-HOCH ₂ -Ph	H	H	H	Ph	2-Furyl-
0	4-HOCH ₂ -Ph	H	H	H	Ph	3-Furyl-
0	4-HOCH ₂ -Ph	H	H	H	Ph	2-Thienyl-
0	4-HOCH ₂ -Ph	H	H	H	Ph	3-Thienyl-
0	4-HOCH ₂ -Ph	H	H	H	Ph	CH ₃ CN
0	4-HOCH ₂ -Ph	H	H	H	Ph	CH ₃ CO ₂ Et
0	4-HOCH ₂ -Ph	H	H	H	Ph	CH ₃ CO ₂ H
0	4-HOCH ₂ -Ph	H	H	H	Ph	(CH ₃) ₂ OH
0	4-HOCH ₂ -Ph	H	H	H	Ph	(CH ₃) ₂ OMe
0	4-HOCH ₂ -Ph	H	H	H	Ph	(CH ₃) ₂ NMe ₂

【表27】

表 27

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
0	4-H ₂ N-Ph	H	H	H	Ph	Me-
0	4-H ₂ N-Ph	H	H	H	Ph	Et-
0	4-H ₂ N-Ph	H	H	H	Ph	ⁿ Pr-
0	4-H ₂ N-Ph	H	H	H	Ph	ⁱ Pr-
0	4-H ₂ N-Ph	H	H	H	Ph	ⁿ Bu-
0	4-H ₂ N-Ph	H	H	H	Ph	ⁱ Bu-
0	4-H ₂ N-Ph	H	H	H	Ph	Cyclopentyl-
0	4-H ₂ N-Ph	H	H	H	Ph	Cyclohexyl-
0	4-H ₂ N-Ph	H	H	H	Ph	Ph-
0	4-H ₂ N-Ph	H	H	H	Ph	2-Pyridyl-
0	4-H ₂ N-Ph	H	H	H	Ph	3-Pyridyl-
0	4-H ₂ N-Ph	H	H	H	Ph	4-Pyridyl-
0	4-H ₂ N-Ph	H	H	H	Ph	2-Furyl-
0	4-H ₂ N-Ph	H	H	H	Ph	3-Furyl-
0	4-H ₂ N-Ph	H	H	H	Ph	2-Thienyl-
0	4-H ₂ N-Ph	H	H	H	Ph	3-Thienyl-
0	4-H ₂ N-Ph	H	H	H	Ph	CH ₃ CN
0	4-H ₂ N-Ph	H	H	H	Ph	CH ₃ CO ₂ Et
0	4-H ₂ N-Ph	H	H	H	Ph	CH ₃ CO ₂ H
0	4-H ₂ N-Ph	H	H	H	Ph	(CH ₃) ₂ OH
0	4-H ₂ N-Ph	H	H	H	Ph	(CH ₃) ₂ OMe
0	4-H ₂ N-Ph	H	H	H	Ph	(CH ₃) ₂ NMe ₂

【表28】

表 28

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
0	4-O ₂ N-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	Me-
0	4-O ₂ N-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	Et-
0	4-O ₂ N-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	ⁿ Pr-
0	4-O ₂ N-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	ⁱ Pr-
0	4-O ₂ N-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	^t Bu-
0	4-O ₂ N-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	ⁱ Bu-
0	4-O ₂ N-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	Cyclohexyl-
0	4-O ₂ N-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	Cyclohexyl-
0	4-O ₂ N-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	Cyclohexyl-
0	4-O ₂ N-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	Ph-
0	4-O ₂ N-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	2-Pyridyl-
0	4-O ₂ N-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	3-Pyridyl-
0	4-O ₂ N-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	4-Pyridyl-
0	4-O ₂ N-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	2-Furyl-
0	4-O ₂ N-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	3-Furyl-
0	4-O ₂ N-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	2-Thienyl-
0	4-O ₂ N-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	3-Thienyl-
0	4-O ₂ N-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	-CH ₂ CN
0	4-O ₂ N-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	-CH ₂ CO ₂ Et
0	4-O ₂ N-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	-CH ₂ CO ₂ H
0	4-O ₂ N-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	-(CH ₂) ₂ OH
0	4-O ₂ N-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	-(CH ₂) ₂ OMe
0	4-O ₂ N-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	-(CH ₂) ₂ NMe ₂

【表29】

表 29

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
0	4-NC-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	Me-
0	4-NC-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	Et-
0	4-NC-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	ⁿ Pr-
0	4-NC-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	ⁱ Pr-
0	4-NC-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	^t Bu-
0	4-NC-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	ⁱ Bu-
0	4-NC-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	Cyclohexyl-
0	4-NC-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	Cyclohexyl-
0	4-NC-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	Ph-
0	4-NC-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	2-Pyridyl-
0	4-NC-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	3-Pyridyl-
0	4-NC-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	4-Pyridyl-
0	4-NC-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	2-Furyl-
0	4-NC-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	3-Furyl-
0	4-NC-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	2-Thienyl-
0	4-NC-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	3-Thienyl-
0	4-NC-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	-CH ₂ CN
0	4-NC-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	-CH ₂ CO ₂ Et
0	4-NC-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	-CH ₂ CO ₂ H
0	4-NC-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	-(CH ₂) ₂ OH
0	4-NC-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	-(CH ₂) ₂ OMe
0	4-NC-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	-(CH ₂) ₂ NMe ₂

【表30】

表 30

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
0	4-H ₂ NCO-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	Me-
0	4-H ₂ NCO-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	Et-
0	4-H ₂ NCO-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	ⁿ Pr-
0	4-H ₂ NCO-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	ⁱ Pr-
0	4-H ₂ NCO-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	ⁿ Bu-
0	4-H ₂ NCO-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	ⁱ Bu-
0	4-H ₂ NCO-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	Cyclopentyl-
0	4-H ₂ NCO-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	Cyclohexyl-
0	4-H ₂ NCO-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	Ph-
0	4-H ₂ NCO-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	2-Pyridyl-
0	4-H ₂ NCO-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	3-Pyridyl-
0	4-H ₂ NCO-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	4-Pyridyl-
0	4-H ₂ NCO-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	2-Furyl-
0	4-H ₂ NCO-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	3-Furyl-
0	4-H ₂ NCO-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	2-Thienyl-
0	4-H ₂ NCO-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	3-Thienyl-
0	4-H ₂ NCO-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	-CH ₂ CN
0	4-H ₂ NCO-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	-CH ₂ CO ₂ Et
0	4-H ₂ NCO-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	-CH ₂ CO ₂ H
0	4-H ₂ NCO-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	-(CH ₂) ₂ OH
0	4-H ₂ NCO-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	-(CH ₂) ₂ OMe
0	4-H ₂ NCO-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	-(CH ₂) ₂ NMe ₂

【0026】

【表 3 1】

【表 3 2】

表 31

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
0	4- ⁿ BuNHCO-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	Me-
0	4- ⁿ BuNHCO-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	Et-
0	4- ⁿ BuNHCO-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	ⁿ Pr-
0	4- ⁿ BuNHCO-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	ⁱ Pr-
0	4- ⁿ BuNHCO-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	ⁿ Bu-
0	4- ⁿ BuNHCO-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	ⁱ Bu-
0	4- ⁿ BuNHCO-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	Cyclopentyl-
0	4- ⁿ BuNHCO-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	Cyclohexyl-
0	4- ⁿ BuNHCO-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	Ph-
0	4- ⁿ BuNHCO-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	2-Pyridyl-
0	4- ⁿ BuNHCO-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	3-Pyridyl-
0	4- ⁿ BuNHCO-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	4-Pyridyl-
0	4- ⁿ BuNHCO-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	2-Furyl-
0	4- ⁿ BuNHCO-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	3-Furyl-
0	4- ⁿ BuNHCO-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	2-Thienyl-
0	4- ⁿ BuNHCO-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	3-Thienyl-
0	4- ⁿ BuNHCO-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	-CH ₂ CN
0	4- ⁿ BuNHCO-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	-CH ₂ CO ₂ Et
0	4- ⁿ BuNHCO-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	-CH ₂ CO ₂ H
0	4- ⁿ BuNHCO-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	-(CH ₂) ₂ OH
0	4- ⁿ BuNHCO-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	-(CH ₂) ₂ OMe
0	4- ⁿ BuNHCO-Ph-	-H	-H	-H	Ph-	-(CH ₂) ₂ NMe ₂

表 82

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
0	PhCH ₂ -	-H	-H	-H	Ph-	Me-
0	PhCH ₂ -	-H	-H	-H	Ph-	Et-
0	PhCH ₂ -	-H	-H	-H	Ph-	ⁿ Pr-
0	PhCH ₂ -	-H	-H	-H	Ph-	ⁱ Pr-
0	PhCH ₂ -	-H	-H	-H	Ph-	^t Bu-
0	PhCH ₂ -	-H	-H	-H	Ph-	Bu-
0	PhCH ₂ -	-H	-H	-H	Ph-	Cyclopentyl-
0	PhCH ₂ -	-H	-H	-H	Ph-	Cyclohexyl-
0	PhCH ₂ -	-H	-H	-H	Ph-	Ph-
0	PhCH ₂ -	-H	-H	-H	Ph-	2-Pyridyl-
0	PhCH ₂ -	-H	-H	-H	Ph-	3-Pyridyl-
0	PhCH ₂ -	-H	-H	-H	Ph-	4-Pyridyl-
0	PhCH ₂ -	-H	-H	-H	Ph-	2-Furyl-
0	PhCH ₂ -	-H	-H	-H	Ph-	3-Furyl-
0	PhCH ₂ -	-H	-H	-H	Ph-	2-Thienyl-
0	PhCH ₂ -	-H	-H	-H	Ph-	3-Thienyl-
0	PhCH ₂ -	-H	-H	-H	Ph-	-CH ₂ CN
0	PhCH ₂ -	-H	-H	-H	Ph-	-CH ₂ CO ₂ Et
0	PhCH ₂ -	-H	-H	-H	Ph-	-CH ₂ CO ₂ H
0	PhCH ₂ -	-H	-H	-H	Ph-	-(CH ₂) ₂ OH
0	PhCH ₂ -	-H	-H	-H	Ph-	-(CH ₂) ₂ OMe
0	PhCH ₂ -	-H	-H	-H	Ph-	-(CH ₂) ₂ NMe ₂

【表33】

表 83

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
0	Me-	-H	-H	-CN	Ph-	Me-
0	Me-	-H	-H	-CN	Ph-	Et-
0	Me-	-H	-H	-CN	Ph-	ⁿ Pr-
0	Me-	-H	-H	-CN	Ph-	ⁱ Pr-
0	Me-	-H	-H	-CN	Ph-	^t Bu-
0	Me-	-H	-H	-CN	Ph-	Bu-
0	Me-	-H	-H	-CN	Ph-	Cyclopentyl-
0	Me-	-H	-H	-CN	Ph-	Cyclohexyl-
0	Me-	-H	-H	-CN	Ph-	Ph-
0	Me-	-H	-H	-CN	Ph-	2-Pyridyl-
0	Me-	-H	-H	-CN	Ph-	3-Pyridyl-
0	Me-	-H	-H	-CN	Ph-	4-Pyridyl-
0	Me-	-H	-H	-CN	Ph-	2-Furyl-
0	Me-	-H	-H	-CN	Ph-	3-Furyl-
0	Me-	-H	-H	-CN	Ph-	2-Thienyl-
0	Me-	-H	-H	-CN	Ph-	3-Thienyl-
0	Me-	-H	-H	-CN	Ph-	-CH ₂ CN
0	Me-	-H	-H	-CN	Ph-	-CH ₂ CO ₂ Et
0	Me-	-H	-H	-CN	Ph-	-CH ₂ CO ₂ H
0	Me-	-H	-H	-CN	Ph-	-(CH ₂) ₂ OH
0	Me-	-H	-H	-CN	Ph-	-(CH ₂) ₂ OMe
0	Me-	-H	-H	-CN	Ph-	-(CH ₂) ₂ NMe ₂

【表34】

表 84

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
0	Cyclohexyl-	-H	-H	-CN	Ph-	Me-
0	Cyclohexyl-	-H	-H	-CN	Ph-	Et-
0	Cyclohexyl-	-H	-H	-CN	Ph-	ⁿ Pr-
0	Cyclohexyl-	-H	-H	-CN	Ph-	ⁿ Pr-
0	Cyclohexyl-	-H	-H	-CN	Ph-	ⁿ Bu-
0	Cyclohexyl-	-H	-H	-CN	Ph-	ⁱ Bu-
0	Cyclohexyl-	-H	-H	-CN	Ph-	Cyclopentyl-
0	Cyclohexyl-	-H	-H	-CN	Ph-	Cyclohexyl-
0	Cyclohexyl-	-H	-H	-CN	Ph-	Ph-
0	Cyclohexyl-	-H	-H	-CN	Ph-	2-Pyridyl-
0	Cyclohexyl-	-H	-H	-CN	Ph-	3-Pyridyl-
0	Cyclohexyl-	-H	-H	-CN	Ph-	4-Pyridyl-
0	Cyclohexyl-	-H	-H	-CN	Ph-	2-Furyl-
0	Cyclohexyl-	-H	-H	-CN	Ph-	3-Furyl-
0	Cyclohexyl-	-H	-H	-CN	Ph-	2-Thienyl-
0	Cyclohexyl-	-H	-H	-CN	Ph-	3-Thienyl-
0	Cyclohexyl-	-H	-H	-CN	Ph-	-CH ₂ CN
0	Cyclohexyl-	-H	-H	-CN	Ph-	-CH ₂ CO ₂ Et
0	Cyclohexyl-	-H	-H	-CN	Ph-	-CH ₂ CO ₂ H
0	Cyclohexyl-	-H	-H	-CN	Ph-	-(CH ₂) ₂ OH
0	Cyclohexyl-	-H	-H	-CN	Ph-	-(CH ₂) ₂ OMe
0	Cyclohexyl-	-H	-H	-CN	Ph-	-(CH ₂) ₂ NMe ₂

【表 3 5】

表 85

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
0	Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	Me-
0	Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	Et-
0	Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	ⁿ Pr-
0	Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	ⁿ Pr-
0	Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	ⁿ Bu-
0	Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	ⁱ Bu-
0	Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	Cyclopentyl-
0	Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	Cyclohexyl-
0	Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	Ph-
0	Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	2-Pyridyl-
0	Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	3-Pyridyl-
0	Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	4-Pyridyl-
0	Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	2-Furyl-
0	Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	3-Furyl-
0	Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	2-Thienyl-
0	Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	3-Thienyl-
0	Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	-CH ₂ CN
0	Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	-CH ₂ CO ₂ Et
0	Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	-CH ₂ CO ₂ H
0	Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	-(CH ₂) ₂ OH
0	Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	-(CH ₂) ₂ OMe
0	Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	-(CH ₂) ₂ NMe ₂

【表 3 6】

表 86

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
0	2-Me-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	Me-
0	2-Me-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	Et-
0	2-Me-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	ⁿ Pr-
0	2-Me-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	ⁱ Pr-
0	2-Me-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	ⁿ Bu-
0	2-Me-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	ⁱ Bu-
0	2-Me-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	Cl ₂ -
0	2-Me-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	Cyclopentyl-
0	2-Me-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	Cyclohexyl-
0	2-Me-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	Ph-
0	2-Me-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	2-Pyridyl-
0	2-Me-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	3-Pyridyl-
0	2-Me-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	4-Pyridyl-
0	2-Me-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	2-Furyl-
0	2-Me-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	3-Furyl-
0	2-Me-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	2-Thienyl-
0	2-Me-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	3-Thienyl-
0	2-Me-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	-CH ₂ CN
0	2-Me-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	-CH ₂ CO ₂ Et
0	2-Me-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	-CH ₂ CO ₂ H
0	2-Me-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	-(CH ₂) ₂ OH
0	2-Me-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	-(CH ₂) ₂ OMe
0	2-Me-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	-(CH ₂) ₂ NMe ₂

【表37】

表 87

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
0	3-Me-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	Me-
0	3-Me-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	Et-
0	3-Me-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	ⁿ Pr-
0	3-Me-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	ⁱ Pr-
0	3-Me-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	ⁿ Bu-
0	3-Me-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	ⁱ Bu-
0	3-Me-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	Cyclopentyl-
0	3-Me-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	Cyclohexyl-
0	3-Me-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	Ph-
0	3-Me-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	2-Pyridyl-
0	3-Me-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	3-Pyridyl-
0	3-Me-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	4-Pyridyl-
0	3-Me-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	2-Furyl-
0	3-Me-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	3-Furyl-
0	3-Me-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	2-Thienyl-
0	3-Me-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	3-Thienyl-
0	3-Me-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	-CH ₂ CN
0	3-Me-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	-CH ₂ CO ₂ Et
0	3-Me-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	-CH ₂ CO ₂ H
0	3-Me-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	-(CH ₂) ₂ OH
0	3-Me-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	-(CH ₂) ₂ OMe
0	3-Me-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	-(CH ₂) ₂ NMe ₂

【表38】

表 88

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
0	4-Me-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	Me-
0	4-Me-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	Et-
0	4-Me-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	ⁿ Pr-
0	4-Me-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	ⁱ Pr-
0	4-Me-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	ⁿ Bu-
0	4-Me-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	ⁱ Bu-
0	4-Me-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	C ₂ F ₅ -
0	4-Me-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	Cyclohexyl-
0	4-Me-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	Cyclohexyl- Ph-
0	4-Me-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	Ph-
0	4-Me-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	2-Pyridyl-
0	4-Me-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	3-Pyridyl-
0	4-Me-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	4-Pyridyl-
0	4-Me-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	4-Pyridyl-
0	4-Me-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	2-Furyl-
0	4-Me-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	3-Furyl-
0	4-Me-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	2-Thienyl-
0	4-Me-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	3-Thienyl-
0	4-Me-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	CH ₂ CN
0	4-Me-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	CH ₂ CO ₂ Et
0	4-Me-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	CH ₂ CO ₂ H
0	4-Me-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	(CH ₂) ₂ OH
0	4-Me-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	(CH ₂) ₂ OMe
0	4-Me-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	(CH ₂) ₂ NMe ₂

【表39】

表 89

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
0	4-Et-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	Me-
0	4-Et-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	Et-
0	4-Et-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	ⁿ Pr-
0	4-Et-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	ⁱ Pr-
0	4-Et-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	ⁿ Bu-
0	4-Et-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	ⁱ Bu-
0	4-Et-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	Cyclohexyl-
0	4-Et-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	Cyclohexyl- Ph-
0	4-Et-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	Ph-
0	4-Et-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	2-Pyridyl-
0	4-Et-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	3-Pyridyl-
0	4-Et-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	4-Pyridyl-
0	4-Et-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	4-Pyridyl-
0	4-Et-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	2-Furyl-
0	4-Et-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	3-Furyl-
0	4-Et-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	2-Thienyl-
0	4-Et-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	3-Thienyl-
0	4-Et-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	CH ₂ CN
0	4-Et-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	CH ₂ CO ₂ Et
0	4-Et-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	CH ₂ CO ₂ H
0	4-Et-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	(CH ₂) ₂ OH
0	4-Et-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	(CH ₂) ₂ OMe
0	4-Et-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	(CH ₂) ₂ NMe ₂

【表40】

表 40

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
0	4-Pr-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	Me-
0	4-Pr-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	Et-
0	4-Pr-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	ⁱ Pr-
0	4-Pr-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	ⁿ Pr-
0	4-Pr-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	^{iso} Bu-
0	4-Pr-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	^{tert} Bu-
0	4-Pr-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	Cyclohexyl-
0	4-Pr-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	Cyclohexyl- Ph-
0	4-Pr-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	2-Pyridyl- Ph-
0	4-Pr-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	2-Pyridyl-
0	4-Pr-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	3-Pyridyl-
0	4-Pr-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	4-Pyridyl-
0	4-Pr-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	2-Furyl-
0	4-Pr-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	3-Furyl-
0	4-Pr-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	2-Thienyl-
0	4-Pr-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	3-Thienyl-
0	4-Pr-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	CH ₃ CN
0	4-Pr-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	CH ₃ CO ₂ Et
0	4-Pr-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	(CH ₃) ₂ COH
0	4-Pr-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	(CH ₃) ₂ OMe
0	4-Pr-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	(CH ₃) ₂ NMe ₂

[0027]

[表41]

表 41

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
0	4-Pr-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	Me-
0	4-Pr-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	Et-
0	4-Pr-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	ⁱ Pr-
0	4-Pr-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	ⁿ Pr-
0	4-Pr-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	^{iso} Bu-
0	4-Pr-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	^{tert} Bu-
0	4-Pr-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	Cyclohexyl-
0	4-Pr-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	Cyclohexyl- Ph-
0	4-Pr-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	2-Pyridyl- Ph-
0	4-Pr-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	2-Pyridyl-
0	4-Pr-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	3-Pyridyl-
0	4-Pr-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	4-Pyridyl-
0	4-Pr-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	2-Furyl-
0	4-Pr-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	3-Furyl-
0	4-Pr-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	2-Thienyl-
0	4-Pr-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	3-Thienyl-
0	4-Pr-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	CH ₃ CN
0	4-Pr-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	CH ₃ CO ₂ Et
0	4-Pr-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	(CH ₃) ₂ COH
0	4-Pr-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	(CH ₃) ₂ OMe
0	4-Pr-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	(CH ₃) ₂ NMe ₂

[表42]

表 12

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
0	2- ^t Bu-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	Me-
0	2- ^t Bu-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	Et-
0	2- ^t Bu-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	ⁿ Pr-
0	2- ^t Bu-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	ⁱ Pr-
0	2- ^t Bu-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	ⁿ Bu-
0	2- ^t Bu-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	ⁱ Bu-
0	2- ^t Bu-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	Cyclopentyl-
0	2- ^t Bu-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	Cyclohexyl-
0	2- ^t Bu-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	Ph-
0	2- ^t Bu-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	2-Pyridyl-
0	2- ^t Bu-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	3-Pyridyl-
0	2- ^t Bu-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	4-Pyridyl-
0	2- ^t Bu-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	2-Furyl-
0	2- ^t Bu-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	3-Furyl-
0	2- ^t Bu-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	2-Thienyl-
0	2- ^t Bu-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	3-Thienyl-
0	2- ^t Bu-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	-CH ₂ CN
0	2- ^t Bu-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	-CH ₂ CO ₂ Et
0	2- ^t Bu-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	-CH ₂ CO ₂ H
0	2- ^t Bu-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	-(CH ₂) ₂ OH
0	2- ^t Bu-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	-(CH ₂) ₂ OMe
0	2- ^t Bu-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	-(CH ₂) ₂ NMe ₂

【表 4.3】

表 13

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
0	3- ⁿ Bu-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	Me-
0	3- ⁿ Bu-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	Et-
0	3- ⁿ Bu-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	ⁿ Pr-
0	3- ⁿ Bu-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	ⁱ Pr-
0	3- ⁿ Bu-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	ⁿ Bu-
0	3- ⁿ Bu-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	ⁱ Bu-
0	3- ⁿ Bu-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	Cyclopentyl-
0	3- ⁿ Bu-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	Cyclohexyl-
0	3- ⁿ Bu-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	Ph-
0	3- ⁿ Bu-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	2-Pyridyl-
0	3- ⁿ Bu-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	3-Pyridyl-
0	3- ⁿ Bu-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	4-Pyridyl-
0	3- ⁿ Bu-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	2-Furyl-
0	3- ⁿ Bu-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	3-Furyl-
0	3- ⁿ Bu-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	2-Thienyl-
0	3- ⁿ Bu-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	3-Thienyl-
0	3- ⁿ Bu-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	-CH ₂ CN
0	3- ⁿ Bu-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	-CH ₂ CO ₂ Et
0	3- ⁿ Bu-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	-CH ₂ CO ₂ H
0	3- ⁿ Bu-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	-(CH ₂) ₂ OH
0	3- ⁿ Bu-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	-(CH ₂) ₂ OMe
0	3- ⁿ Bu-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	-(CH ₂) ₂ NMe ₂

【表 4.4】

表 44

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
0	4 ⁿ Bu-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	Me-
0	4 ⁿ Bu-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	Et-
0	4 ⁿ Bu-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	ⁿ Pr-
0	4 ⁿ Bu-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	ⁱ Pr-
0	4 ⁿ Bu-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	^t Bu-
0	4 ⁿ Bu-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	Cyclopentyl-
0	4 ⁿ Bu-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	Cyclohexyl-
0	4 ⁿ Bu-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	Ph-
0	4 ⁿ Bu-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	2-Pyridyl-
0	4 ⁿ Bu-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	3-Pyridyl-
0	4 ⁿ Bu-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	4-Pyridyl-
0	4 ⁿ Bu-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	2-Furyl-
0	4 ⁿ Bu-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	3-Furyl-
0	4 ⁿ Bu-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	2-Thienyl-
0	4 ⁿ Bu-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	3-Thienyl-
0	4 ⁿ Bu-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	CH ₂ CN
0	4 ⁿ Bu-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	CH ₂ CO ₂ Et
0	4 ⁿ Bu-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	CH ₂ CO ₂ H
0	4 ⁿ Bu-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	(CH ₂) ₂ OH
0	4 ⁿ Bu-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	(CH ₂) ₂ OMe
0	4 ⁿ Bu-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	(CH ₂) ₂ NMe ₂

【表 45】

表 45

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
0	4 ⁿ Bu-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	Me-
0	4 ⁿ Bu-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	Et-
0	4 ⁿ Bu-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	ⁿ Pr-
0	4 ⁿ Bu-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	ⁱ Pr-
0	4 ⁿ Bu-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	^t Bu-
0	4 ⁿ Bu-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	Cyclopentyl-
0	4 ⁿ Bu-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	Cyclohexyl-
0	4 ⁿ Bu-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	Ph-
0	4 ⁿ Bu-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	2-Pyridyl-
0	4 ⁿ Bu-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	3-Pyridyl-
0	4 ⁿ Bu-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	4-Pyridyl-
0	4 ⁿ Bu-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	2-Furyl-
0	4 ⁿ Bu-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	3-Furyl-
0	4 ⁿ Bu-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	2-Thienyl-
0	4 ⁿ Bu-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	3-Thienyl-
0	4 ⁿ Bu-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	CH ₂ CN
0	4 ⁿ Bu-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	CH ₂ CO ₂ Et
0	4 ⁿ Bu-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	CH ₂ CO ₂ H
0	4 ⁿ Bu-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	(CH ₂) ₂ OH
0	4 ⁿ Bu-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	(CH ₂) ₂ OMe
0	4 ⁿ Bu-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	(CH ₂) ₂ NMe ₂

【表 46】

表 48

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
0	2-C ₆ H ₅ -	-H	-H	-ON	Ph-	Me-
0	2-C ₆ H ₅ -	-H	-H	-ON	Ph-	Et-
0	2-C ₆ H ₅ -	-H	-H	-ON	Ph-	ⁿ Pr-
0	2-C ₆ H ₅ -	-H	-H	-ON	Ph-	ⁿ Bu-
0	2-C ₆ H ₅ -	-H	-H	-ON	Ph-	ⁿ Bu-
0	2-C ₆ H ₅ -	-H	-H	-ON	Ph-	CF ₃ -
0	2-C ₆ H ₅ -	-H	-H	-ON	Ph-	Cyclohexyl-
0	2-C ₆ H ₅ -	-H	-H	-ON	Ph-	Cyclohexyl-
0	2-C ₆ H ₅ -	-H	-H	-ON	Ph-	Ph-
0	2-C ₆ H ₅ -	-H	-H	-ON	Ph-	2-Pyridyl-
0	2-C ₆ H ₅ -	-H	-H	-ON	Ph-	3-Pyridyl-
0	2-C ₆ H ₅ -	-H	-H	-ON	Ph-	4-Pyridyl-
0	2-C ₆ H ₅ -	-H	-H	-ON	Ph-	2-Furyl-
0	2-C ₆ H ₅ -	-H	-H	-ON	Ph-	3-Furyl-
0	2-C ₆ H ₅ -	-H	-H	-ON	Ph-	2-Thienyl-
0	2-C ₆ H ₅ -	-H	-H	-ON	Ph-	3-Thienyl-
0	2-C ₆ H ₅ -	-H	-H	-ON	Ph-	CH ₃ Cl-
0	2-C ₆ H ₅ -	-H	-H	-ON	Ph-	CH ₃ CO ₂ Et-
0	2-C ₆ H ₅ -	-H	-H	-ON	Ph-	-CH ₂ CO ₂ H
0	2-C ₆ H ₅ -	-H	-H	-ON	Ph-	-(CH ₂) ₂ OH
0	2-C ₆ H ₅ -	-H	-H	-ON	Ph-	-(CH ₂) ₂ OMe
0	2-C ₆ H ₅ -	-H	-H	-ON	Ph-	-(CH ₂) ₂ NNMe ₂

【表47】

表 47

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
0	3-Ci-Ph-	H	H	-CN	Ph-	Me-
0	3-Ci-Ph-	H	H	-CN	Ph-	Et-
0	3-Ci-Ph-	H	H	-CN	Ph-	ⁿ Pr-
0	3-Ci-Ph-	H	H	-CN	Ph-	ⁱ Pr-
0	3-Ci-Ph-	H	H	-CN	Ph-	^t Bu-
0	3-Ci-Ph-	H	H	-CN	Ph-	Cyclopentyl-
0	3-Ci-Ph-	H	H	-CN	Ph-	Cyclohexyl-
0	3-Ci-Ph-	H	H	-CN	Ph-	Ph-
0	3-Ci-Ph-	H	H	-CN	Ph-	2-Pyridyl-
0	3-Ci-Ph-	H	H	-CN	Ph-	3-Pyridyl-
0	3-Ci-Ph-	H	H	-CN	Ph-	4-Pyridyl-
0	3-Ci-Ph-	H	H	-CN	Ph-	2-Furyl-
0	3-Ci-Ph-	H	H	-CN	Ph-	3-Furyl-
0	3-Ci-Ph-	H	H	-CN	Ph-	2-Thienyl-
0	3-Ci-Ph-	H	H	-CN	Ph-	3-Thienyl-
0	3-Ci-Ph-	H	H	-CN	Ph-	O-CH ₃
0	3-Ci-Ph-	H	H	-CN	Ph-	-O-CH ₂ CO ₂ Et
0	3-Ci-Ph-	H	H	-CN	Ph-	-O-CH ₂ CO ₂ H
0	3-Ci-Ph-	H	H	-CN	Ph-	-(CH ₂) ₂ OH
0	3-Ci-Ph-	H	H	-CN	Ph-	-(CH ₂) ₂ OMe
0	3-Ci-Ph-	H	H	-CN	Ph-	-(CH ₂) ₂ NMe ₂

【表48】

表 48

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
0	4-O-Ph-	H	H	-CN	Ph-	Me-
0	4-O-Ph-	H	H	-CN	Ph-	Et-
0	4-O-Ph-	H	H	-CN	Ph-	ⁿ Pr-
0	4-O-Ph-	H	H	-CN	Ph-	ⁱ Pr-
0	4-O-Ph-	H	H	-CN	Ph-	ⁿ Bu-
0	4-O-Ph-	H	H	-CN	Ph-	ⁱ Bu-
0	4-O-Ph-	H	H	-CN	Ph-	CF ₃ -
0	4-O-Ph-	H	H	-CN	Ph-	Cyclopentyl-
0	4-O-Ph-	H	H	-CN	Ph-	Cyclohexyl-
0	4-O-Ph-	H	H	-CN	Ph-	Ph-
0	4-O-Ph-	H	H	-CN	Ph-	2-Pyridyl-
0	4-O-Ph-	H	H	-CN	Ph-	3-Pyridyl-
0	4-O-Ph-	H	H	-CN	Ph-	4-Pyridyl-
0	4-O-Ph-	H	H	-CN	Ph-	2-Furyl-
0	4-O-Ph-	H	H	-CN	Ph-	3-Furyl-
0	4-O-Ph-	H	H	-CN	Ph-	2-Thienyl-
0	4-O-Ph-	H	H	-CN	Ph-	3-Thienyl-
0	4-O-Ph-	H	H	-CN	Ph-	-CH ₂ CN
0	4-O-Ph-	H	H	-CN	Ph-	-CH ₂ CO ₂ Et
0	4-O-Ph-	H	H	-CN	Ph-	-CH ₂ CO ₂ H
0	4-O-Ph-	H	H	-CN	Ph-	-(CH ₂) ₂ OH
0	4-O-Ph-	H	H	-CN	Ph-	-(CH ₂) ₂ OMe
0	4-O-Ph-	H	H	-CN	Ph-	-(CH ₂) ₂ NMe ₂

【表 49】

表 49

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
0	4-Br-Ph-	H	H	-CN	Ph-	Me-
0	4-Br-Ph-	H	H	-CN	Ph-	Et-
0	4-Br-Ph-	H	H	-CN	Ph-	ⁿ Pr-
0	4-Br-Ph-	H	H	-CN	Ph-	ⁱ Pr-
0	4-Br-Ph-	H	H	-CN	Ph-	ⁿ Bu-
0	4-Br-Ph-	H	H	-CN	Ph-	ⁱ Bu-
0	4-Br-Ph-	H	H	-CN	Ph-	Cyclopentyl-
0	4-Br-Ph-	H	H	-CN	Ph-	Cyclohexyl-
0	4-Br-Ph-	H	H	-CN	Ph-	Ph-
0	4-Br-Ph-	H	H	-CN	Ph-	2-Pyridyl-
0	4-Br-Ph-	H	H	-CN	Ph-	3-Pyridyl-
0	4-Br-Ph-	H	H	-CN	Ph-	4-Pyridyl-
0	4-Br-Ph-	H	H	-CN	Ph-	2-Furyl-
0	4-Br-Ph-	H	H	-CN	Ph-	3-Furyl-
0	4-Br-Ph-	H	H	-CN	Ph-	2-Thienyl-
0	4-Br-Ph-	H	H	-CN	Ph-	3-Thienyl-
0	4-Br-Ph-	H	H	-CN	Ph-	-CH ₂ CN
0	4-Br-Ph-	H	H	-CN	Ph-	-CH ₂ CO ₂ Et
0	4-Br-Ph-	H	H	-CN	Ph-	-CH ₂ CO ₂ H
0	4-Br-Ph-	H	H	-CN	Ph-	-(CH ₂) ₂ OH
0	4-Br-Ph-	H	H	-CN	Ph-	-(CH ₂) ₂ OMe
0	4-Br-Ph-	H	H	-CN	Ph-	-(CH ₂) ₂ NMe ₂

【表 50】

表 60

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
0	4-F-Ph	H	H	-CN	Ph	Me
0	4-F-Ph	H	H	-CN	Ph	Et
0	4-F-Ph	H	H	-CN	Ph	ⁿ Pr
0	4-F-Ph	H	H	-CN	Ph	ⁱ Pr
0	4-F-Ph	H	H	-CN	Ph	ⁿ Bu
0	4-F-Ph	H	H	-CN	Ph	ⁱ Bu
0	4-F-Ph	H	H	-CN	Ph	Cyclopentyl
0	4-F-Ph	H	H	-CN	Ph	Cyclohexyl
0	4-F-Ph	H	H	-CN	Ph	Ph
0	4-F-Ph	H	H	-CN	Ph	2-Pyridyl
0	4-F-Ph	H	H	-CN	Ph	3-Pyridyl
0	4-F-Ph	H	H	-CN	Ph	4-Pyridyl
0	4-F-Ph	H	H	-CN	Ph	2-Furyl
0	4-F-Ph	H	H	-CN	Ph	3-Furyl
0	4-F-Ph	H	H	-CN	Ph	2-Thienyl
0	4-F-Ph	H	H	-CN	Ph	3-Thienyl
0	4-F-Ph	H	H	-CN	Ph	-CH ₂ CN
0	4-F-Ph	H	H	-CN	Ph	-CH ₂ CO ₂ Et
0	4-F-Ph	H	H	-CN	Ph	-CH ₂ CO ₂ H
0	4-F-Ph	H	H	-CN	Ph	-(CH ₂) ₂ OH
0	4-F-Ph	H	H	-CN	Ph	-(CH ₂) ₂ OMe
0	4-F-Ph	H	H	-CN	Ph	-(CH ₂) ₂ NMe ₂

[0028]

[表51]

[表52]

表 61

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
0	4-F-Ph	H	H	-CN	Ph	Me
0	4-F-Ph	H	H	-CN	Ph	Et
0	4-F-Ph	H	H	-CN	Ph	ⁿ Pr
0	4-F-Ph	H	H	-CN	Ph	ⁱ Pr
0	4-F-Ph	H	H	-CN	Ph	ⁿ Bu
0	4-F-Ph	H	H	-CN	Ph	ⁱ Bu
0	4-F-Ph	H	H	-CN	Ph	Cyclopentyl
0	4-F-Ph	H	H	-CN	Ph	Cyclohexyl
0	4-F-Ph	H	H	-CN	Ph	Ph
0	4-F-Ph	H	H	-CN	Ph	2-Pyridyl
0	4-F-Ph	H	H	-CN	Ph	3-Pyridyl
0	4-F-Ph	H	H	-CN	Ph	4-Pyridyl
0	4-F-Ph	H	H	-CN	Ph	2-Furyl
0	4-F-Ph	H	H	-CN	Ph	3-Furyl
0	4-F-Ph	H	H	-CN	Ph	2-Thienyl
0	4-F-Ph	H	H	-CN	Ph	3-Thienyl
0	4-F-Ph	H	H	-CN	Ph	-CH ₂ CN
0	4-F-Ph	H	H	-CN	Ph	-CH ₂ CO ₂ Et
0	4-F-Ph	H	H	-CN	Ph	-CH ₂ CO ₂ H
0	4-F-Ph	H	H	-CN	Ph	-(CH ₂) ₂ OH
0	4-F-Ph	H	H	-CN	Ph	-(CH ₂) ₂ OMe
0	4-F-Ph	H	H	-CN	Ph	-(CH ₂) ₂ NMe ₂

表 52

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
0	1-Naphthyl-	-H	-H	-CN	Ph-	Me-
0	1-Naphthyl-	-H	-H	-CN	Ph-	Et-
0	1-Naphthyl-	-H	-H	-CN	Ph-	Pr-
0	1-Naphthyl-	-H	-H	-CN	Ph-	Is-
0	1-Naphthyl-	-H	-H	-CN	Ph-	Bu-
0	1-Naphthyl-	-H	-H	-CN	Ph-	Cyclopentyl-
0	1-Naphthyl-	-H	-H	-CN	Ph-	Cyclohexyl-
0	1-Naphthyl-	-H	-H	-CN	Ph-	Ph-
0	1-Naphthyl-	-H	-H	-CN	Ph-	2-Pyridyl-
0	1-Naphthyl-	-H	-H	-CN	Ph-	3-Pyridyl-
0	1-Naphthyl-	-H	-H	-CN	Ph-	4-Pyridyl-
0	1-Naphthyl-	-H	-H	-CN	Ph-	2-Furyl-
0	1-Naphthyl-	-H	-H	-CN	Ph-	3-Furyl-
0	1-Naphthyl-	-H	-H	-CN	Ph-	2-Thienyl-
0	1-Naphthyl-	-H	-H	-CN	Ph-	3-Thienyl-
0	1-Naphthyl-	-H	-H	-CN	Ph-	-CH ₂ -CN
0	1-Naphthyl-	-H	-H	-CN	Ph-	-CH ₂ CO ₂ Et
0	1-Naphthyl-	-H	-H	-CN	Ph-	-CH ₂ CO ₂ H
0	1-Naphthyl-	-H	-H	-CN	Ph-	-(CH ₂) ₂ OH
0	1-Naphthyl-	-H	-H	-CN	Ph-	-(CH ₂) ₂ OMe
0	1-Naphthyl-	-H	-H	-CN	Ph-	-(CH ₂) ₂ NMe ₂

【表53】

第 63 页

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
0	2-Naphthyl-	-H	-H	-CN	Ph-	Me-
0	2-Naphthyl-	-H	-H	-CN	Ph-	Et-
0	2-Naphthyl-	-H	-H	-CN	Ph-	Pr-
0	2-Naphthyl-	-H	-H	-CN	Ph-	Is ^a -
0	2-Naphthyl-	-H	-H	-CN	Ph-	Is ^b -
0	2-Naphthyl-	-H	-H	-CN	Ph-	Cyclohexyl-
0	2-Naphthyl-	-H	-H	-CN	Ph-	Cyclohexyl-
0	2-Naphthyl-	-H	-H	-CN	Ph-	Cyclohexyl-
0	2-Naphthyl-	-H	-H	-CN	Ph-	Ph-
0	2-Naphthyl-	-H	-H	-CN	Ph-	2-Pyridyl-
0	2-Naphthyl-	-H	-H	-CN	Ph-	3-Pyridyl-
0	2-Naphthyl-	-H	-H	-CN	Ph-	4-Pyridyl-
0	2-Naphthyl-	-H	-H	-CN	Ph-	2-Furyl-
0	2-Naphthyl-	-H	-H	-CN	Ph-	3-Furyl-
0	2-Naphthyl-	-H	-H	-CN	Ph-	2-Thienyl-
0	2-Naphthyl-	-H	-H	-CN	Ph-	3-Thienyl-
0	2-Naphthyl-	-H	-H	-CN	Ph-	-CH ₂ CO ₂ Et
0	2-Naphthyl-	-H	-H	-CN	Ph-	-CH ₂ CO ₂ H
0	2-Naphthyl-	-H	-H	-CN	Ph-	-CH ₂ OH
0	2-Naphthyl-	-H	-H	-CN	Ph-	(-CH ₂) ₂ OH
0	2-Naphthyl-	-H	-H	-CN	Ph-	(-CH ₂) ₃ NH ₂

【表54】

表 54

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
0	4-MeODC-Ph	H	H	CN	Ph	Me
0	4-MeODC-Ph	H	H	CN	Ph	Et
0	4-MeODC-Ph	H	H	CN	Ph	Pr
0	4-MeODC-Ph	H	H	CN	Ph	Pr
0	4-MeODC-Ph	H	H	CN	Ph	Bu
0	4-MeODC-Ph	H	H	CN	Ph	Cyclopentyl
0	4-MeODC-Ph	H	H	CN	Ph	Cyclohexyl
0	4-MeODC-Ph	H	H	CN	Ph	Ph
0	4-MeODC-Ph	H	H	CN	Ph	2-Pyridyl
0	4-MeODC-Ph	H	H	CN	Ph	3-Pyridyl
0	4-MeODC-Ph	H	H	CN	Ph	4-Pyridyl
0	4-MeODC-Ph	H	H	CN	Ph	2-Furyl
0	4-MeODC-Ph	H	H	CN	Ph	3-Furyl
0	4-MeODC-Ph	H	H	CN	Ph	2-Thienyl
0	4-MeODC-Ph	H	H	CN	Ph	3-Thienyl
0	4-MeODC-Ph	H	H	CN	Ph	CH ₂ CN
0	4-MeODC-Ph	H	H	CN	Ph	CH ₂ CO ₂ Et
0	4-MeODC-Ph	H	H	CN	Ph	CH ₂ CO ₂ H
0	4-MeODC-Ph	H	H	CN	Ph	(CH ₂) ₂ OH
0	4-MeODC-Ph	H	H	CN	Ph	(CH ₂) ₂ OMe
0	4-MeODC-Ph	H	H	CN	Ph	(CH ₂) ₂ NMe ₂

【表 5.5】

表 55

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
0	4-HO-Ph	H	H	CN	Ph	Me
0	4-HO-Ph	H	H	CN	Ph	Et
0	4-HO-Ph	H	H	CN	Ph	Pr
0	4-HO-Ph	H	H	CN	Ph	Pr
0	4-HO-Ph	H	H	CN	Ph	Bu
0	4-HO-Ph	H	H	CN	Ph	Cyclopentyl
0	4-HO-Ph	H	H	CN	Ph	Cyclohexyl
0	4-HO-Ph	H	H	CN	Ph	Ph
0	4-HO-Ph	H	H	CN	Ph	2-Pyridyl
0	4-HO-Ph	H	H	CN	Ph	3-Pyridyl
0	4-HO-Ph	H	H	CN	Ph	4-Pyridyl
0	4-HO-Ph	H	H	CN	Ph	2-Furyl
0	4-HO-Ph	H	H	CN	Ph	3-Furyl
0	4-HO-Ph	H	H	CN	Ph	2-Thienyl
0	4-HO-Ph	H	H	CN	Ph	3-Thienyl
0	4-HO-Ph	H	H	CN	Ph	CH ₂ CN
0	4-HO-Ph	H	H	CN	Ph	CH ₂ CO ₂ Et
0	4-HO-Ph	H	H	CN	Ph	CH ₂ CO ₂ H
0	4-HO-Ph	H	H	CN	Ph	(CH ₂) ₂ OH
0	4-HO-Ph	H	H	CN	Ph	(CH ₂) ₂ OMe
0	4-HO-Ph	H	H	CN	Ph	(CH ₂) ₂ NMe ₂

【表 5.6】

表 56

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
0	4-HOOC-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	Me-
0	4-HOOC-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	Et-
0	4-HOOC-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	ⁿ Pr-
0	4-HOOC-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	ⁱ Pr-
0	4-HOOC-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	^t Bu-
0	4-HOOC-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	Cyclopentyl-
0	4-HOOC-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	Cyclohexyl-
0	4-HOOC-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	Ph-
0	4-HOOC-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	2-Pyridyl-
0	4-HOOC-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	3-Pyridyl-
0	4-HOOC-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	4-Pyridyl-
0	4-HOOC-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	2-Furyl-
0	4-HOOC-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	3-Furyl-
0	4-HOOC-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	2-Thienyl-
0	4-HOOC-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	3-Thienyl-
0	4-HOOC-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	-CH ₂ CN
0	4-HOOC-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	-CH ₂ CO ₂ Et
0	4-HOOC-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	-CH ₂ CO ₂ H
0	4-HOOC-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	-(CH ₂) ₂ OH
0	4-HOOC-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	-(CH ₂) ₂ OMe
0	4-HOOC-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	-(CH ₂) ₂ NMe ₂

【表 57】

表 57

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
0	4-MeO-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	Me-
0	4-MeO-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	Et-
0	4-MeO-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	ⁿ Pr-
0	4-MeO-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	ⁱ Pr-
0	4-MeO-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	^t Bu-
0	4-MeO-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	Cyclopentyl-
0	4-MeO-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	Cyclohexyl-
0	4-MeO-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	Ph-
0	4-MeO-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	2-Pyridyl-
0	4-MeO-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	3-Pyridyl-
0	4-MeO-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	4-Pyridyl-
0	4-MeO-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	2-Furyl-
0	4-MeO-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	3-Furyl-
0	4-MeO-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	2-Thienyl-
0	4-MeO-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	3-Thienyl-
0	4-MeO-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	-CH ₂ CN
0	4-MeO-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	-CH ₂ CO ₂ Et
0	4-MeO-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	-CH ₂ CO ₂ H
0	4-MeO-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	-(CH ₂) ₂ OH
0	4-MeO-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	-(CH ₂) ₂ OMe
0	4-MeO-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	-(CH ₂) ₂ NMe ₂

【表 58】

表 58

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
0	4-HOCH ₂ -Ph	-H	-H	-CN	Ph-	Me-
0	4-HOCH ₂ -Ph	-H	-H	-CN	Ph-	Et-
0	4-HOCH ₂ -Ph	-H	-H	-CN	Ph-	ⁿ Pr-
0	4-HOCH ₂ -Ph	-H	-H	-CN	Ph-	ⁱ Pr-
0	4-HOCH ₂ -Ph	-H	-H	-CN	Ph-	Bu-
0	4-HOCH ₂ -Ph	-H	-H	-CN	Ph-	Bu-
0	4-HOCH ₂ -Ph	-H	-H	-CN	Ph-	Cyclopentyl-
0	4-HOCH ₂ -Ph	-H	-H	-CN	Ph-	Cyclohexyl-
0	4-HOCH ₂ -Ph	-H	-H	-CN	Ph-	Ph-
0	4-HOCH ₂ -Ph	-H	-H	-CN	Ph-	2-Pyridyl-
0	4-HOCH ₂ -Ph	-H	-H	-CN	Ph-	3-Pyridyl-
0	4-HOCH ₂ -Ph	-H	-H	-CN	Ph-	4-Pyridyl-
0	4-HOCH ₂ -Ph	-H	-H	-CN	Ph-	2-Furyl-
0	4-HOCH ₂ -Ph	-H	-H	-CN	Ph-	3-Furyl-
0	4-HOCH ₂ -Ph	-H	-H	-CN	Ph-	2-Thienyl-
0	4-HOCH ₂ -Ph	-H	-H	-CN	Ph-	3-Thienyl-
0	4-HOCH ₂ -Ph	-H	-H	-CN	Ph-	-CH ₂ CN
0	4-HOCH ₂ -Ph	-H	-H	-CN	Ph-	-CH ₂ CO ₂ Et
0	4-HOCH ₂ -Ph	-H	-H	-CN	Ph-	-CH ₂ CO ₂ H
0	4-HOCH ₂ -Ph	-H	-H	-CN	Ph-	-(CH ₂) ₂ OH
0	4-HOCH ₂ -Ph	-H	-H	-CN	Ph-	-(CH ₂) ₂ OMe
0	4-HOCH ₂ -Ph	-H	-H	-CN	Ph-	-(CH ₂) ₂ NMe ₂

【表 59】

表 59

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
0	4-H ₂ N-Ph	-H	-H	-CN	Ph-	Me-
0	4-H ₂ N-Ph	-H	-H	-CN	Ph-	Et-
0	4-H ₂ N-Ph	-H	-H	-CN	Ph-	ⁿ Pr-
0	4-H ₂ N-Ph	-H	-H	-CN	Ph-	ⁱ Pr-
0	4-H ₂ N-Ph	-H	-H	-CN	Ph-	Bu-
0	4-H ₂ N-Ph	-H	-H	-CN	Ph-	Bu-
0	4-H ₂ N-Ph	-H	-H	-CN	Ph-	Cyclopentyl-
0	4-H ₂ N-Ph	-H	-H	-CN	Ph-	Cyclohexyl-
0	4-H ₂ N-Ph	-H	-H	-CN	Ph-	Ph-
0	4-H ₂ N-Ph	-H	-H	-CN	Ph-	2-Pyridyl-
0	4-H ₂ N-Ph	-H	-H	-CN	Ph-	3-Pyridyl-
0	4-H ₂ N-Ph	-H	-H	-CN	Ph-	4-Pyridyl-
0	4-H ₂ N-Ph	-H	-H	-CN	Ph-	2-Furyl-
0	4-H ₂ N-Ph	-H	-H	-CN	Ph-	3-Furyl-
0	4-H ₂ N-Ph	-H	-H	-CN	Ph-	2-Thienyl-
0	4-H ₂ N-Ph	-H	-H	-CN	Ph-	3-Thienyl-
0	4-H ₂ N-Ph	-H	-H	-CN	Ph-	-CH ₂ CN
0	4-H ₂ N-Ph	-H	-H	-CN	Ph-	-CH ₂ CO ₂ Et
0	4-H ₂ N-Ph	-H	-H	-CN	Ph-	-CH ₂ CO ₂ H
0	4-H ₂ N-Ph	-H	-H	-CN	Ph-	-(CH ₂) ₂ OH
0	4-H ₂ N-Ph	-H	-H	-CN	Ph-	-(CH ₂) ₂ OMe
0	4-H ₂ N-Ph	-H	-H	-CN	Ph-	-(CH ₂) ₂ NMe ₂

【表 60】

表 80

[0029]

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
0	4-O ₂ N-Ph	H	H	-CN	Ph	Me
0	4-O ₂ N-Ph	H	H	-CN	Ph	Et
0	4-O ₂ N-Ph	H	H	-CN	Ph	ⁿ Pr
0	4-O ₂ N-Ph	H	H	-CN	Ph	ⁱ Pr
0	4-O ₂ N-Ph	H	H	-CN	Ph	^t Bu
0	4-O ₂ N-Ph	H	H	-CN	Ph	ⁿ Bu
0	4-O ₂ N-Ph	H	H	-CN	Ph	Cyclopentyl
0	4-O ₂ N-Ph	H	H	-CN	Ph	Cyclohexyl
0	4-O ₂ N-Ph	H	H	-CN	Ph	Ph
0	4-O ₂ N-Ph	H	H	-CN	Ph	2-Pyridyl
0	4-O ₂ N-Ph	H	H	-CN	Ph	3-Pyridyl
0	4-O ₂ N-Ph	H	H	-CN	Ph	4-Pyridyl
0	4-O ₂ N-Ph	H	H	-CN	Ph	2-Furyl
0	4-O ₂ N-Ph	H	H	-CN	Ph	3-Furyl
0	4-O ₂ N-Ph	H	H	-CN	Ph	2-Thienyl
0	4-O ₂ N-Ph	H	H	-CN	Ph	3-Thienyl
0	4-O ₂ N-Ph	H	H	-CN	Ph	-CH ₂ CN
0	4-O ₂ N-Ph	H	H	-CN	Ph	-CH ₂ CO ₂ Et
0	4-O ₂ N-Ph	H	H	-CN	Ph	-CH ₂ CO ₂ H
0	4-O ₂ N-Ph	H	H	-CN	Ph	-(CH ₂) ₂ OH
0	4-O ₂ N-Ph	H	H	-CN	Ph	-(CH ₂) ₂ OMe
0	4-O ₂ N-Ph	H	H	-CN	Ph	-(CH ₂) ₂ NMe ₂

[表 61]

[表 62]

表 81

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
0	4-NC-Ph	H	H	-CN	Ph	Me
0	4-NC-Ph	H	H	-CN	Ph	Et
0	4-NC-Ph	H	H	-CN	Ph	ⁿ Pr
0	4-NC-Ph	H	H	-CN	Ph	ⁱ Pr
0	4-NC-Ph	H	H	-CN	Ph	^t Bu
0	4-NC-Ph	H	H	-CN	Ph	ⁿ Bu
0	4-NC-Ph	H	H	-CN	Ph	Cyclopentyl
0	4-NC-Ph	H	H	-CN	Ph	Cyclohexyl
0	4-NC-Ph	H	H	-CN	Ph	Ph
0	4-NC-Ph	H	H	-CN	Ph	2-Pyridyl
0	4-NC-Ph	H	H	-CN	Ph	3-Pyridyl
0	4-NC-Ph	H	H	-CN	Ph	4-Pyridyl
0	4-NC-Ph	H	H	-CN	Ph	2-Furyl
0	4-NC-Ph	H	H	-CN	Ph	3-Furyl
0	4-NC-Ph	H	H	-CN	Ph	2-Thienyl
0	4-NC-Ph	H	H	-CN	Ph	3-Thienyl
0	4-NC-Ph	H	H	-CN	Ph	-CH ₂ CN
0	4-NC-Ph	H	H	-CN	Ph	-CH ₂ CO ₂ Et
0	4-NC-Ph	H	H	-CN	Ph	-CH ₂ CO ₂ H
0	4-NC-Ph	H	H	-CN	Ph	-(CH ₂) ₂ OH
0	4-NC-Ph	H	H	-CN	Ph	-(CH ₂) ₂ OMe
0	4-NC-Ph	H	H	-CN	Ph	-(CH ₂) ₂ NMe ₂

表 63

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
0	4-H ₂ NCO-Ph	-H	-H	-CN	Ph-	Me-
0	4-H ₂ NCO-Ph	-H	-H	-CN	Ph-	Et-
0	4-H ₂ NCO-Ph	-H	-H	-CN	Ph-	ⁿ Pr-
0	4-H ₂ NCO-Ph	-H	-H	-CN	Ph-	ⁱ Pr-
0	4-H ₂ NCO-Ph	-H	-H	-CN	Ph-	^t Bu-
0	4-H ₂ NCO-Ph	-H	-H	-CN	Ph-	Bu-
0	4-H ₂ NCO-Ph	-H	-H	-CN	Ph-	Cyclohexyl-
0	4-H ₂ NCO-Ph	-H	-H	-CN	Ph-	Cyclohexyl-
0	4-H ₂ NCO-Ph	-H	-H	-CN	Ph-	Ph-
0	4-H ₂ NCO-Ph	-H	-H	-CN	Ph-	2-Pyridyl-
0	4-H ₂ NCO-Ph	-H	-H	-CN	Ph-	3-Pyridyl-
0	4-H ₂ NCO-Ph	-H	-H	-CN	Ph-	4-Pyridyl-
0	4-H ₂ NCO-Ph	-H	-H	-CN	Ph-	2-Furyl-
0	4-H ₂ NCO-Ph	-H	-H	-CN	Ph-	3-Furyl-
0	4-H ₂ NCO-Ph	-H	-H	-CN	Ph-	2-Thienyl-
0	4-H ₂ NCO-Ph	-H	-H	-CN	Ph-	3-Thienyl-
0	4-H ₂ NCO-Ph	-H	-H	-CN	Ph-	4-Thienyl-
0	4-H ₂ NCO-Ph	-H	-H	-CN	Ph-	-CH ₂ CN
0	4-H ₂ NCO-Ph	-H	-H	-CN	Ph-	-CH ₂ CO ₂ Et
0	4-H ₂ NCO-Ph	-H	-H	-CN	Ph-	-CH ₂ CO ₂ H
0	4-H ₂ NCO-Ph	-H	-H	-CN	Ph-	-(CH ₂) ₂ OH
0	4-H ₂ NCO-Ph	-H	-H	-CN	Ph-	-(CH ₂) ₂ OMe
0	4-H ₂ NCO-Ph	-H	-H	-CN	Ph-	-(CH ₂) ₂ NMe ₂

【表 6 3】

表 63

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
0	4- ^t BuNHCO-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	Me-
0	4- ^t BuNHCO-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	Et-
0	4- ^t BuNHCO-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	ⁿ Pr-
0	4- ^t BuNHCO-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	ⁱ Pr-
0	4- ^t BuNHCO-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	^t Bu-
0	4- ^t BuNHCO-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	Bu-
0	4- ^t BuNHCO-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	Cyclohexyl-
0	4- ^t BuNHCO-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	Cyclohexyl-
0	4- ^t BuNHCO-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	Ph-
0	4- ^t BuNHCO-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	2-Pyridyl-
0	4- ^t BuNHCO-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	3-Pyridyl-
0	4- ^t BuNHCO-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	4-Pyridyl-
0	4- ^t BuNHCO-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	2-Furyl-
0	4- ^t BuNHCO-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	3-Furyl-
0	4- ^t BuNHCO-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	2-Thienyl-
0	4- ^t BuNHCO-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	3-Thienyl-
0	4- ^t BuNHCO-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	-CH ₂ CN
0	4- ^t BuNHCO-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	-CH ₂ CO ₂ Et
0	4- ^t BuNHCO-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	-CH ₂ CO ₂ H
0	4- ^t BuNHCO-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	-(CH ₂) ₂ OH
0	4- ^t BuNHCO-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	-(CH ₂) ₂ OMe
0	4- ^t BuNHCO-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	-(CH ₂) ₂ NMe ₂

【表 6 4】

表 64

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
0	PhCH ₂ -	-H	-H	-CN	Ph-	Me-
0	PhCH ₂ -	-H	-H	-CN	Ph-	Et-
0	PhCH ₂ -	-H	-H	-CN	Ph-	ⁿ Pr-
0	PhCH ₂ -	-H	-H	-CN	Ph-	ⁱ Pr-
0	PhCH ₂ -	-H	-H	-CN	Ph-	ⁿ Bu-
0	PhCH ₂ -	-H	-H	-CN	Ph-	ⁱ Bu-
0	PhCH ₂ -	-H	-H	-CN	Ph-	Cyclopentyl-
0	PhCH ₂ -	-H	-H	-CN	Ph-	Cyclohexyl-
0	PhCH ₂ -	-H	-H	-CN	Ph-	Ph-
0	PhCH ₂ -	-H	-H	-CN	Ph-	2-Pyridyl-
0	PhCH ₂ -	-H	-H	-CN	Ph-	3-Pyridyl-
0	PhCH ₂ -	-H	-H	-CN	Ph-	4-Pyridyl-
0	PhCH ₂ -	-H	-H	-CN	Ph-	2-Furyl-
0	PhCH ₂ -	-H	-H	-CN	Ph-	3-Furyl-
0	PhCH ₂ -	-H	-H	-CN	Ph-	2-Thienyl-
0	PhCH ₂ -	-H	-H	-CN	Ph-	3-Thienyl-
0	PhCH ₂ -	-H	-H	-CN	Ph-	-CH ₂ CN
0	PhCH ₂ -	-H	-H	-CN	Ph-	-CH ₂ CO ₂ Et
0	PhCH ₂ -	-H	-H	-CN	Ph-	-CH ₂ CO ₂ H
0	PhCH ₂ -	-H	-H	-CN	Ph-	-(CH ₂) ₂ OH
0	PhCH ₂ -	-H	-H	-CN	Ph-	-(CH ₂) ₂ OMe
0	PhCH ₂ -	-H	-H	-CN	Ph-	-(CH ₂) ₂ NMe ₂

【表 65】

表 65

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
0	PhCH ₂ -	-H	-H	-CN	Ph-	Me-
0	PhCH ₂ -	-H	-H	-CN	Ph-	Et-
0	PhCH ₂ -	-H	-H	-CN	Ph-	ⁿ Pr-
0	PhCH ₂ -	-H	-H	-CN	Ph-	ⁱ Pr-
0	PhCH ₂ -	-H	-H	-CN	Ph-	ⁿ Bu-
0	PhCH ₂ -	-H	-H	-CN	Ph-	ⁱ Bu-
0	PhCH ₂ -	-H	-H	-CN	Ph-	Cyclopentyl-
0	PhCH ₂ -	-H	-H	-CN	Ph-	Cyclohexyl-
0	PhCH ₂ -	-H	-H	-CN	Ph-	Ph-
0	PhCH ₂ -	-H	-H	-CN	Ph-	2-Pyridyl-
0	PhCH ₂ -	-H	-H	-CN	Ph-	3-Pyridyl-
0	PhCH ₂ -	-H	-H	-CN	Ph-	4-Pyridyl-
0	PhCH ₂ -	-H	-H	-CN	Ph-	2-Furyl-
0	PhCH ₂ -	-H	-H	-CN	Ph-	3-Furyl-
0	PhCH ₂ -	-H	-H	-CN	Ph-	2-Thienyl-
0	PhCH ₂ -	-H	-H	-CN	Ph-	3-Thienyl-
0	PhCH ₂ -	-H	-H	-CN	Ph-	-CH ₂ CN
0	PhCH ₂ -	-H	-H	-CN	Ph-	-CH ₂ CO ₂ Et
0	PhCH ₂ -	-H	-H	-CN	Ph-	-CH ₂ CO ₂ H
0	PhCH ₂ -	-H	-H	-CN	Ph-	-(CH ₂) ₂ OH
0	PhCH ₂ -	-H	-H	-CN	Ph-	-(CH ₂) ₂ OMe
0	PhCH ₂ -	-H	-H	-CN	Ph-	-(CH ₂) ₂ NMe ₂

【表 66】

表 66

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
0	Me-	H	H	-COOEt	Ph-	Me-
0	Me-	H	H	-COOEt	Ph-	Et-
0	Me-	H	H	-COOEt	Ph-	ⁿ Pr-
0	Me-	H	H	-COOEt	Ph-	ⁱ Pr-
0	Me-	H	H	-COOEt	Ph-	^t Bu-
0	Me-	H	H	-COOEt	Ph-	^t Bu-
0	Me-	H	H	-COOEt	Ph-	Cyclopentyl-
0	Me-	H	H	-COOEt	Ph-	Cyclohexyl-
0	Me-	H	H	-COOEt	Ph-	Ph-
0	Me-	H	H	-COOEt	Ph-	2-Pyridyl-
0	Me-	H	H	-COOEt	Ph-	3-Pyridyl-
0	Me-	H	H	-COOEt	Ph-	4-Pyridyl-
0	Me-	H	H	-COOEt	Ph-	2-Furyl-
0	Me-	H	H	-COOEt	Ph-	3-Furyl-
0	Me-	H	H	-COOEt	Ph-	2-Thienyl-
0	Me-	H	H	-COOEt	Ph-	3-Thienyl-
0	Me-	H	H	-COOEt	Ph-	-CH ₂ CN
0	Me-	H	H	-COOEt	Ph-	-CH ₂ CO ₂ Et
0	Me-	H	H	-COOEt	Ph-	-CH ₂ CO ₂ H
0	Me-	H	H	-COOEt	Ph-	-(CH ₂) ₂ OH
0	Me-	H	H	-COOEt	Ph-	-(CH ₂) ₂ OMe
0	Me-	H	H	-COOEt	Ph-	-(CH ₂) ₂ NMe ₂

【表 67】

表 67

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
0	Cyclohexyl-	H	H	-COOEt	Ph-	Me-
0	Cyclohexyl-	H	H	-COOEt	Ph-	Et-
0	Cyclohexyl-	H	H	-COOEt	Ph-	ⁿ Pr-
0	Cyclohexyl-	H	H	-COOEt	Ph-	ⁱ Pr-
0	Cyclohexyl-	H	H	-COOEt	Ph-	^t Bu-
0	Cyclohexyl-	H	H	-COOEt	Ph-	^t Bu-
0	Cyclohexyl-	H	H	-COOEt	Ph-	Cyclopentyl-
0	Cyclohexyl-	H	H	-COOEt	Ph-	Cyclohexyl-
0	Cyclohexyl-	H	H	-COOEt	Ph-	Ph-
0	Cyclohexyl-	H	H	-COOEt	Ph-	2-Pyridyl-
0	Cyclohexyl-	H	H	-COOEt	Ph-	3-Pyridyl-
0	Cyclohexyl-	H	H	-COOEt	Ph-	4-Pyridyl-
0	Cyclohexyl-	H	H	-COOEt	Ph-	2-Furyl-
0	Cyclohexyl-	H	H	-COOEt	Ph-	3-Furyl-
0	Cyclohexyl-	H	H	-COOEt	Ph-	2-Thienyl-
0	Cyclohexyl-	H	H	-COOEt	Ph-	3-Thienyl-
0	Cyclohexyl-	H	H	-COOEt	Ph-	-CH ₂ CN
0	Cyclohexyl-	H	H	-COOEt	Ph-	-CH ₂ CO ₂ Et
0	Cyclohexyl-	H	H	-COOEt	Ph-	-CH ₂ CO ₂ H
0	Cyclohexyl-	H	H	-COOEt	Ph-	-(CH ₂) ₂ OH
0	Cyclohexyl-	H	H	-COOEt	Ph-	-(CH ₂) ₂ OMe
0	Cyclohexyl-	H	H	-COOEt	Ph-	-(CH ₂) ₂ NMe ₂

【表 68】

表 68

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
0	Ph-	H	H	-COOEt	Ph-	Me-
0	Ph-	H	H	-COOEt	Ph-	Et-
0	Ph-	H	H	-COOEt	Ph-	ⁿ Pr-
0	Ph-	H	H	-COOEt	Ph-	ⁱ Pr-
0	Ph-	H	H	-COOEt	Ph-	^t Bu-
0	Ph-	H	H	-COOEt	Ph-	ⁱ Bu-
0	Ph-	H	H	-COOEt	Ph-	Cyclopentyl-
0	Ph-	H	H	-COOEt	Ph-	Cyclohexyl-
0	Ph-	H	H	-COOEt	Ph-	Ph-
0	Ph-	H	H	-COOEt	Ph-	2-Pyridyl-
0	Ph-	H	H	-COOEt	Ph-	3-Pyridyl-
0	Ph-	H	H	-COOEt	Ph-	4-Pyridyl-
0	Ph-	H	H	-COOEt	Ph-	2-Furyl-
0	Ph-	H	H	-COOEt	Ph-	3-Furyl-
0	Ph-	H	H	-COOEt	Ph-	2-Thienyl-
0	Ph-	H	H	-COOEt	Ph-	3-Thienyl-
0	Ph-	H	H	-COOEt	Ph-	-CH ₂ CN
0	Ph-	H	H	-COOEt	Ph-	-CH ₂ CO ₂ Et
0	Ph-	H	H	-COOEt	Ph-	-CH ₂ CO ₂ H
0	Ph-	H	H	-COOEt	Ph-	-(CH ₂) ₂ OH
0	Ph-	H	H	-COOEt	Ph-	-(CH ₂) ₂ OMe
0	Ph-	H	H	-COOEt	Ph-	-(CH ₂) ₂ NMe ₂

【表 69】

表 69

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
0	2-Me-Ph-	H	H	-COOEt	Ph-	Me-
0	2-Me-Ph-	H	H	-COOEt	Ph-	Et-
0	2-Me-Ph-	H	H	-COOEt	Ph-	ⁿ Pr-
0	2-Me-Ph-	H	H	-COOEt	Ph-	ⁱ Pr-
0	2-Me-Ph-	H	H	-COOEt	Ph-	^t Bu-
0	2-Me-Ph-	H	H	-COOEt	Ph-	ⁱ Bu-
0	2-Me-Ph-	H	H	-COOEt	Ph-	Cyclopentyl-
0	2-Me-Ph-	H	H	-COOEt	Ph-	Cyclohexyl-
0	2-Me-Ph-	H	H	-COOEt	Ph-	Ph-
0	2-Me-Ph-	H	H	-COOEt	Ph-	2-Pyridyl-
0	2-Me-Ph-	H	H	-COOEt	Ph-	3-Pyridyl-
0	2-Me-Ph-	H	H	-COOEt	Ph-	4-Pyridyl-
0	2-Me-Ph-	H	H	-COOEt	Ph-	2-Furyl-
0	2-Me-Ph-	H	H	-COOEt	Ph-	3-Furyl-
0	2-Me-Ph-	H	H	-COOEt	Ph-	2-Thienyl-
0	2-Me-Ph-	H	H	-COOEt	Ph-	3-Thienyl-
0	2-Me-Ph-	H	H	-COOEt	Ph-	-CH ₂ CN
0	2-Me-Ph-	H	H	-COOEt	Ph-	-CH ₂ CO ₂ Et
0	2-Me-Ph-	H	H	-COOEt	Ph-	-CH ₂ CO ₂ H
0	2-Me-Ph-	H	H	-COOEt	Ph-	-(CH ₂) ₂ OH
0	2-Me-Ph-	H	H	-COOEt	Ph-	-(CH ₂) ₂ OMe
0	2-Me-Ph-	H	H	-COOEt	Ph-	-(CH ₂) ₂ NMe ₂

【表 70】

表 70

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
0	3-Me-Ph-	H	H	-COOEt	Ph-	Me-
0	3-Me-Ph-	H	H	-COOEt	Ph-	Et-
0	3-Me-Ph-	H	H	-COOEt	Ph-	ⁿ Pr-
0	3-Me-Ph-	H	H	-COOEt	Ph-	ⁱ Pr-
0	3-Me-Ph-	H	H	-COOEt	Ph-	ⁿ Bu-
0	3-Me-Ph-	H	H	-COOEt	Ph-	ⁱ Bu-
0	3-Me-Ph-	H	H	-COOEt	Ph-	Cyclopentyl-
0	3-Me-Ph-	H	H	-COOEt	Ph-	Cyclohexyl-
0	3-Me-Ph-	H	H	-COOEt	Ph-	Ph-
0	3-Me-Ph-	H	H	-COOEt	Ph-	2-Pyridyl-
0	3-Me-Ph-	H	H	-COOEt	Ph-	3-Pyridyl-
0	3-Me-Ph-	H	H	-COOEt	Ph-	4-Pyridyl-
0	3-Me-Ph-	H	H	-COOEt	Ph-	2-Furyl-
0	3-Me-Ph-	H	H	-COOEt	Ph-	3-Furyl-
0	3-Me-Ph-	H	H	-COOEt	Ph-	2-Thienyl-
0	3-Me-Ph-	H	H	-COOEt	Ph-	3-Thienyl-
0	3-Me-Ph-	H	H	-COOEt	Ph-	CH ₂ CN
0	3-Me-Ph-	H	H	-COOEt	Ph-	CH ₂ CO ₂ Et
0	3-Me-Ph-	H	H	-COOEt	Ph-	CH ₂ CO ₂ H
0	3-Me-Ph-	H	H	-COOEt	Ph-	(CH ₂) ₂ OH
0	3-Me-Ph-	H	H	-COOEt	Ph-	(CH ₂) ₂ OMe
0	3-Me-Ph-	H	H	-COOEt	Ph-	(CH ₂) ₂ NMe ₂

【0030】

【表71】

【表72】

表 71

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
0	4-Me-Ph-	H	H	-COOEt	Ph-	Me-
0	4-Me-Ph-	H	H	-COOEt	Ph-	Et-
0	4-Me-Ph-	H	H	-COOEt	Ph-	ⁿ Pr-
0	4-Me-Ph-	H	H	-COOEt	Ph-	ⁱ Pr-
0	4-Me-Ph-	H	H	-COOEt	Ph-	ⁿ Bu-
0	4-Me-Ph-	H	H	-COOEt	Ph-	ⁱ Bu-
0	4-Me-Ph-	H	H	-COOEt	Ph-	Cyclopentyl-
0	4-Me-Ph-	H	H	-COOEt	Ph-	Cyclohexyl-
0	4-Me-Ph-	H	H	-COOEt	Ph-	Ph-
0	4-Me-Ph-	H	H	-COOEt	Ph-	2-Pyridyl-
0	4-Me-Ph-	H	H	-COOEt	Ph-	3-Pyridyl-
0	4-Me-Ph-	H	H	-COOEt	Ph-	4-Pyridyl-
0	4-Me-Ph-	H	H	-COOEt	Ph-	2-Furyl-
0	4-Me-Ph-	H	H	-COOEt	Ph-	3-Furyl-
0	4-Me-Ph-	H	H	-COOEt	Ph-	2-Thienyl-
0	4-Me-Ph-	H	H	-COOEt	Ph-	3-Thienyl-
0	4-Me-Ph-	H	H	-COOEt	Ph-	CH ₂ CN
0	4-Me-Ph-	H	H	-COOEt	Ph-	CH ₂ CO ₂ Et
0	4-Me-Ph-	H	H	-COOEt	Ph-	CH ₂ CO ₂ H
0	4-Me-Ph-	H	H	-COOEt	Ph-	(CH ₂) ₂ OH
0	4-Me-Ph-	H	H	-COOEt	Ph-	(CH ₂) ₂ OMe
0	4-Me-Ph-	H	H	-COOEt	Ph-	(CH ₂) ₂ NMe ₂

表 72

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
0	2-Cl-Ph-	-H	-H	-COOEt	Ph-	Me-
0	2-Cl-Ph-	-H	-H	-COOEt	Ph-	Et-
0	2-Cl-Ph-	-H	-H	-COOEt	Ph-	ⁿ Pr-
0	2-Cl-Ph-	-H	-H	-COOEt	Ph-	ⁱ Pr-
0	2-Cl-Ph-	-H	-H	-COOEt	Ph-	ⁿ Bu-
0	2-Cl-Ph-	-H	-H	-COOEt	Ph-	ⁱ Bu-
0	2-Cl-Ph-	-H	-H	-COOEt	Ph-	Cyclopentyl-
0	2-Cl-Ph-	-H	-H	-COOEt	Ph-	Cyclohexyl-
0	2-Cl-Ph-	-H	-H	-COOEt	Ph-	Ph-
0	2-Cl-Ph-	-H	-H	-COOEt	Ph-	2-Pyridyl-
0	2-Cl-Ph-	-H	-H	-COOEt	Ph-	3-Pyridyl-
0	2-Cl-Ph-	-H	-H	-COOEt	Ph-	4-Pyridyl-
0	2-Cl-Ph-	-H	-H	-COOEt	Ph-	2-Furyl-
0	2-Cl-Ph-	-H	-H	-COOEt	Ph-	3-Furyl-
0	2-Cl-Ph-	-H	-H	-COOEt	Ph-	2-Thienyl-
0	2-Cl-Ph-	-H	-H	-COOEt	Ph-	3-Thienyl-
0	2-Cl-Ph-	-H	-H	-COOEt	Ph-	CH ₃ CN
0	2-Cl-Ph-	-H	-H	-COOEt	Ph-	CH ₃ CO ₂ Et
0	2-Cl-Ph-	-H	-H	-COOEt	Ph-	CH ₃ CO ₂ H
0	2-Cl-Ph-	-H	-H	-COOEt	Ph-	(CH ₃) ₂ OH
0	2-Cl-Ph-	-H	-H	-COOEt	Ph-	(CH ₃) ₂ OMe
0	2-Cl-Ph-	-H	-H	-COOEt	Ph-	(CH ₃) ₂ NMe ₂

【表 7 3】

表 73

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
0	3-Cl-Ph-	-H	-H	-COOEt	Ph-	Me-
0	3-Cl-Ph-	-H	-H	-COOEt	Ph-	Et-
0	3-Cl-Ph-	-H	-H	-COOEt	Ph-	ⁿ Pr-
0	3-Cl-Ph-	-H	-H	-COOEt	Ph-	ⁱ Pr-
0	3-Cl-Ph-	-H	-H	-COOEt	Ph-	ⁿ Bu-
0	3-Cl-Ph-	-H	-H	-COOEt	Ph-	ⁱ Bu-
0	3-Cl-Ph-	-H	-H	-COOEt	Ph-	Cyclopentyl-
0	3-Cl-Ph-	-H	-H	-COOEt	Ph-	Cyclohexyl-
0	3-Cl-Ph-	-H	-H	-COOEt	Ph-	Ph-
0	3-Cl-Ph-	-H	-H	-COOEt	Ph-	2-Pyridyl-
0	3-Cl-Ph-	-H	-H	-COOEt	Ph-	3-Pyridyl-
0	3-Cl-Ph-	-H	-H	-COOEt	Ph-	4-Pyridyl-
0	3-Cl-Ph-	-H	-H	-COOEt	Ph-	2-Furyl-
0	3-Cl-Ph-	-H	-H	-COOEt	Ph-	3-Furyl-
0	3-Cl-Ph-	-H	-H	-COOEt	Ph-	2-Thienyl-
0	3-Cl-Ph-	-H	-H	-COOEt	Ph-	3-Thienyl-
0	3-Cl-Ph-	-H	-H	-COOEt	Ph-	CH ₃ CN
0	3-Cl-Ph-	-H	-H	-COOEt	Ph-	CH ₃ CO ₂ Et
0	3-Cl-Ph-	-H	-H	-COOEt	Ph-	CH ₃ CO ₂ H
0	3-Cl-Ph-	-H	-H	-COOEt	Ph-	(CH ₃) ₂ OH
0	3-Cl-Ph-	-H	-H	-COOEt	Ph-	(CH ₃) ₂ OMe
0	3-Cl-Ph-	-H	-H	-COOEt	Ph-	(CH ₃) ₂ NMe ₂

【表 7 4】

表 74

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
0	4-O-Ph-	-H	-H	-COOEt	Ph-	Me-
0	4-O-Ph-	-H	-H	-COOEt	Ph-	Et-
0	4-O-Ph-	-H	-H	-COOEt	Ph-	ⁿ Pr-
0	4-O-Ph-	-H	-H	-COOEt	Ph-	ⁱ Pr-
0	4-O-Ph-	-H	-H	-COOEt	Ph-	^t Bu-
0	4-O-Ph-	-H	-H	-COOEt	Ph-	Bu-
0	4-O-Ph-	-H	-H	-COOEt	Ph-	Cyclohexyl-
0	4-O-Ph-	-H	-H	-COOEt	Ph-	Cyclohexyl-
0	4-O-Ph-	-H	-H	-COOEt	Ph-	Ph-
0	4-O-Ph-	-H	-H	-COOEt	Ph-	2-Pyridyl-
0	4-O-Ph-	-H	-H	-COOEt	Ph-	3-Pyridyl-
0	4-O-Ph-	-H	-H	-COOEt	Ph-	4-Pyridyl-
0	4-O-Ph-	-H	-H	-COOEt	Ph-	2-Furyl-
0	4-O-Ph-	-H	-H	-COOEt	Ph-	3-Furyl-
0	4-O-Ph-	-H	-H	-COOEt	Ph-	2-Thienyl-
0	4-O-Ph-	-H	-H	-COOEt	Ph-	3-Thienyl-
0	4-O-Ph-	-H	-H	-COOEt	Ph-	CH ₂ CN
0	4-O-Ph-	-H	-H	-COOEt	Ph-	CH ₂ CO ₂ Et
0	4-O-Ph-	-H	-H	-COOEt	Ph-	CH ₂ CO ₂ H
0	4-O-Ph-	-H	-H	-COOEt	Ph-	(CH ₂) ₂ OH
0	4-O-Ph-	-H	-H	-COOEt	Ph-	(CH ₂) ₂ OMe
0	4-O-Ph-	-H	-H	-COOEt	Ph-	(CH ₂) ₂ NMe ₂

【表 7 5】

表 76

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
0	Me-	-H	-H	-COOH	Ph-	Me-
0	Me-	-H	-H	-COOH	Ph-	Et-
0	Me-	-H	-H	-COOH	Ph-	ⁿ Pr-
0	Me-	-H	-H	-COOH	Ph-	ⁱ Pr-
0	Me-	-H	-H	-COOH	Ph-	^t Bu-
0	Me-	-H	-H	-COOH	Ph-	Bu-
0	Me-	-H	-H	-COOH	Ph-	Cyclohexyl-
0	Me-	-H	-H	-COOH	Ph-	Cyclohexyl-
0	Me-	-H	-H	-COOH	Ph-	Ph-
0	Me-	-H	-H	-COOH	Ph-	2-Pyridyl-
0	Me-	-H	-H	-COOH	Ph-	3-Pyridyl-
0	Me-	-H	-H	-COOH	Ph-	4-Pyridyl-
0	Me-	-H	-H	-COOH	Ph-	2-Furyl-
0	Me-	-H	-H	-COOH	Ph-	3-Furyl-
0	Me-	-H	-H	-COOH	Ph-	2-Thienyl-
0	Me-	-H	-H	-COOH	Ph-	3-Thienyl-
0	Me-	-H	-H	-COOH	Ph-	CH ₂ CN
0	Me-	-H	-H	-COOH	Ph-	CH ₂ CO ₂ Et
0	Me-	-H	-H	-COOH	Ph-	CH ₂ CO ₂ H
0	Me-	-H	-H	-COOH	Ph-	(CH ₂) ₂ OH
0	Me-	-H	-H	-COOH	Ph-	(CH ₂) ₂ OMe
0	Me-	-H	-H	-COOH	Ph-	(CH ₂) ₂ NMe ₂

【表 7 6】

表 76

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
0	Cyclohexyl-	-H	-H	-COOH	Ph-	Me-
0	Cyclohexyl-	-H	-H	-COOH	Ph-	Et-
0	Cyclohexyl-	-H	-H	-COOH	Ph-	ⁿ Pr-
0	Cyclohexyl-	-H	-H	-COOH	Ph-	^{is} Pr-
0	Cyclohexyl-	-H	-H	-COOH	Ph-	ⁿ Bu-
0	Cyclohexyl-	-H	-H	-COOH	Ph-	^{is} Bu-
0	Cyclohexyl-	-H	-H	-COOH	Ph-	Cyclopentyl-
0	Cyclohexyl-	-H	-H	-COOH	Ph-	Cyclohexyl-
0	Cyclohexyl-	-H	-H	-COOH	Ph-	Ph-
0	Cyclohexyl-	-H	-H	-COOH	Ph-	2-Pyridyl-
0	Cyclohexyl-	-H	-H	-COOH	Ph-	3-Pyridyl-
0	Cyclohexyl-	-H	-H	-COOH	Ph-	4-Pyridyl-
0	Cyclohexyl-	-H	-H	-COOH	Ph-	2-Furyl-
0	Cyclohexyl-	-H	-H	-COOH	Ph-	3-Furyl-
0	Cyclohexyl-	-H	-H	-COOH	Ph-	2-Thienyl-
0	Cyclohexyl-	-H	-H	-COOH	Ph-	3-Thienyl-
0	Cyclohexyl-	-H	-H	-COOH	Ph-	CH ₃ CN
0	Cyclohexyl-	-H	-H	-COOH	Ph-	CH ₃ CO ₂ Et
0	Cyclohexyl-	-H	-H	-COOH	Ph-	CH ₃ CO ₂ H
0	Cyclohexyl-	-H	-H	-COOH	Ph-	(CH ₃) ₂ OH
0	Cyclohexyl-	-H	-H	-COOH	Ph-	(CH ₃) ₂ OMe
0	Cyclohexyl-	-H	-H	-COOH	Ph-	(CH ₃) ₂ NMe ₂

【表 7 7】

表 77

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
0	Ph-	-H	-H	-COOH	Ph-	Me-
0	Ph-	-H	-H	-COOH	Ph-	Et-
0	Ph-	-H	-H	-COOH	Ph-	ⁿ Pr-
0	Ph-	-H	-H	-COOH	Ph-	^{is} Pr-
0	Ph-	-H	-H	-COOH	Ph-	ⁿ Bu-
0	Ph-	-H	-H	-COOH	Ph-	^{is} Bu-
0	Ph-	-H	-H	-COOH	Ph-	Cyclopentyl-
0	Ph-	-H	-H	-COOH	Ph-	Cyclohexyl-
0	Ph-	-H	-H	-COOH	Ph-	Ph-
0	Ph-	-H	-H	-COOH	Ph-	2-Pyridyl-
0	Ph-	-H	-H	-COOH	Ph-	3-Pyridyl-
0	Ph-	-H	-H	-COOH	Ph-	4-Pyridyl-
0	Ph-	-H	-H	-COOH	Ph-	2-Furyl-
0	Ph-	-H	-H	-COOH	Ph-	3-Furyl-
0	Ph-	-H	-H	-COOH	Ph-	2-Thienyl-
0	Ph-	-H	-H	-COOH	Ph-	3-Thienyl-
0	Ph-	-H	-H	-COOH	Ph-	CH ₃ CN
0	Ph-	-H	-H	-COOH	Ph-	CH ₃ CO ₂ Et
0	Ph-	-H	-H	-COOH	Ph-	CH ₃ CO ₂ H
0	Ph-	-H	-H	-COOH	Ph-	(CH ₃) ₂ OH
0	Ph-	-H	-H	-COOH	Ph-	(CH ₃) ₂ OMe
0	Ph-	-H	-H	-COOH	Ph-	(CH ₃) ₂ NMe ₂

【表 7 8】

表 76

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
0	2-Me-Ph-	-H	-H	-COOH	Ph-	Me-
0	2-Me-Ph-	-H	-H	-COOH	Ph-	Et-
0	2-Me-Ph-	-H	-H	-COOH	Ph-	ⁿ Pr-
0	2-Me-Ph-	-H	-H	-COOH	Ph-	ⁱ Pr-
0	2-Me-Ph-	-H	-H	-COOH	Ph-	ⁿ Bu-
0	2-Me-Ph-	-H	-H	-COOH	Ph-	ⁱ Bu-
0	2-Me-Ph-	-H	-H	-COOH	Ph-	Cyclopentyl-
0	2-Me-Ph-	-H	-H	-COOH	Ph-	Cyclohexyl-
0	2-Me-Ph-	-H	-H	-COOH	Ph-	Ph-
0	2-Me-Ph-	-H	-H	-COOH	Ph-	2-Pyridyl-
0	2-Me-Ph-	-H	-H	-COOH	Ph-	3-Pyridyl-
0	2-Me-Ph-	-H	-H	-COOH	Ph-	4-Pyridyl-
0	2-Me-Ph-	-H	-H	-COOH	Ph-	2-Furyl-
0	2-Me-Ph-	-H	-H	-COOH	Ph-	3-Furyl-
0	2-Me-Ph-	-H	-H	-COOH	Ph-	2-Thienyl-
0	2-Me-Ph-	-H	-H	-COOH	Ph-	3-Thienyl-
0	2-Me-Ph-	-H	-H	-COOH	Ph-	CH ₂ CN
0	2-Me-Ph-	-H	-H	-COOH	Ph-	CH ₂ CO ₂ Et
0	2-Me-Ph-	-H	-H	-COOH	Ph-	CH ₂ CO ₂ H
0	2-Me-Ph-	-H	-H	-COOH	Ph-	(CH ₂) ₂ OH
0	2-Me-Ph-	-H	-H	-COOH	Ph-	(CH ₂) ₂ OMe
0	2-Me-Ph-	-H	-H	-COOH	Ph-	(CH ₂) ₂ NMe ₂

【表79】

表 78

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
0	3-Me-Ph-	-H	-H	-COOH	Ph-	Me-
0	3-Me-Ph-	-H	-H	-COOH	Ph-	Et-
0	3-Me-Ph-	-H	-H	-COOH	Ph-	ⁿ Pr-
0	3-Me-Ph-	-H	-H	-COOH	Ph-	ⁱ Pr-
0	3-Me-Ph-	-H	-H	-COOH	Ph-	ⁿ Bu-
0	3-Me-Ph-	-H	-H	-COOH	Ph-	ⁱ Bu-
0	3-Me-Ph-	-H	-H	-COOH	Ph-	Cyclopentyl-
0	3-Me-Ph-	-H	-H	-COOH	Ph-	Cyclohexyl-
0	3-Me-Ph-	-H	-H	-COOH	Ph-	Ph-
0	3-Me-Ph-	-H	-H	-COOH	Ph-	2-Pyridyl-
0	3-Me-Ph-	-H	-H	-COOH	Ph-	3-Pyridyl-
0	3-Me-Ph-	-H	-H	-COOH	Ph-	4-Pyridyl-
0	3-Me-Ph-	-H	-H	-COOH	Ph-	2-Furyl-
0	3-Me-Ph-	-H	-H	-COOH	Ph-	3-Furyl-
0	3-Me-Ph-	-H	-H	-COOH	Ph-	2-Thienyl-
0	3-Me-Ph-	-H	-H	-COOH	Ph-	3-Thienyl-
0	3-Me-Ph-	-H	-H	-COOH	Ph-	CH ₂ CN
0	3-Me-Ph-	-H	-H	-COOH	Ph-	CH ₂ CO ₂ Et
0	3-Me-Ph-	-H	-H	-COOH	Ph-	CH ₂ CO ₂ H
0	3-Me-Ph-	-H	-H	-COOH	Ph-	(CH ₂) ₂ OH
0	3-Me-Ph-	-H	-H	-COOH	Ph-	(CH ₂) ₂ OMe
0	3-Me-Ph-	-H	-H	-COOH	Ph-	(CH ₂) ₂ NMe ₂

【表80】

表 80

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
0	4-Me-Ph-	-H	-H	-COOH	Ph-	Me-
0	4-Me-Ph-	-H	-H	-COOH	Ph-	Et-
0	4-Me-Ph-	-H	-H	-COOH	Ph-	ⁿ Pr-
0	4-Me-Ph-	-H	-H	-COOH	Ph-	ⁱ Pr-
0	4-Me-Ph-	-H	-H	-COOH	Ph-	ⁿ Bu-
0	4-Me-Ph-	-H	-H	-COOH	Ph-	ⁱ Bu-
0	4-Me-Ph-	-H	-H	-COOH	Ph-	Cyclopentyl-
0	4-Me-Ph-	-H	-H	-COOH	Ph-	Cyclohexyl-
0	4-Me-Ph-	-H	-H	-COOH	Ph-	Ph-
0	4-Me-Ph-	-H	-H	-COOH	Ph-	2-Pyridyl-
0	4-Me-Ph-	-H	-H	-COOH	Ph-	3-Pyridyl-
0	4-Me-Ph-	-H	-H	-COOH	Ph-	4-Pyridyl-
0	4-Me-Ph-	-H	-H	-COOH	Ph-	2-Furyl-
0	4-Me-Ph-	-H	-H	-COOH	Ph-	3-Furyl-
0	4-Me-Ph-	-H	-H	-COOH	Ph-	2-Thienyl-
0	4-Me-Ph-	-H	-H	-COOH	Ph-	3-Thienyl-
0	4-Me-Ph-	-H	-H	-COOH	Ph-	-CH ₂ CN
0	4-Me-Ph-	-H	-H	-COOH	Ph-	-CH ₂ CO ₂ Et
0	4-Me-Ph-	-H	-H	-COOH	Ph-	-CH ₂ CO ₂ H
0	4-Me-Ph-	-H	-H	-COOH	Ph-	-(CH ₂) ₂ OH
0	4-Me-Ph-	-H	-H	-COOH	Ph-	-(CH ₂) ₂ OMe
0	4-Me-Ph-	-H	-H	-COOH	Ph-	-(CH ₂) ₂ NMe ₂

【0031】

【表 8 1】

【表 8 2】

表 81

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
0	2-Cl-Ph-	-H	-H	-COOH	Ph-	Me-
0	2-Cl-Ph-	-H	-H	-COOH	Ph-	Et-
0	2-Cl-Ph-	-H	-H	-COOH	Ph-	ⁿ Pr-
0	2-Cl-Ph-	-H	-H	-COOH	Ph-	ⁱ Pr-
0	2-Cl-Ph-	-H	-H	-COOH	Ph-	ⁿ Bu-
0	2-Cl-Ph-	-H	-H	-COOH	Ph-	ⁱ Bu-
0	2-Cl-Ph-	-H	-H	-COOH	Ph-	Cyclopentyl-
0	2-Cl-Ph-	-H	-H	-COOH	Ph-	Cyclohexyl-
0	2-Cl-Ph-	-H	-H	-COOH	Ph-	Ph-
0	2-Cl-Ph-	-H	-H	-COOH	Ph-	2-Pyridyl-
0	2-Cl-Ph-	-H	-H	-COOH	Ph-	3-Pyridyl-
0	2-Cl-Ph-	-H	-H	-COOH	Ph-	4-Pyridyl-
0	2-Cl-Ph-	-H	-H	-COOH	Ph-	2-Furyl-
0	2-Cl-Ph-	-H	-H	-COOH	Ph-	3-Furyl-
0	2-Cl-Ph-	-H	-H	-COOH	Ph-	2-Thienyl-
0	2-Cl-Ph-	-H	-H	-COOH	Ph-	3-Thienyl-
0	2-Cl-Ph-	-H	-H	-COOH	Ph-	-CH ₂ CN
0	2-Cl-Ph-	-H	-H	-COOH	Ph-	-CH ₂ CO ₂ Et
0	2-Cl-Ph-	-H	-H	-COOH	Ph-	-CH ₂ CO ₂ H
0	2-Cl-Ph-	-H	-H	-COOH	Ph-	-(CH ₂) ₂ OH
0	2-Cl-Ph-	-H	-H	-COOH	Ph-	-(CH ₂) ₂ OMe
0	2-Cl-Ph-	-H	-H	-COOH	Ph-	-(CH ₂) ₂ NMe ₂

表 82

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
0	3-Cl-Ph-	H	H	-COOH	Ph-	Me-
0	3-Cl-Ph-	H	H	-COOH	Ph-	Et-
0	3-Cl-Ph-	H	H	-COOH	Ph-	ⁿ Pr-
0	3-Cl-Ph-	H	H	-COOH	Ph-	ⁱ Pr-
0	3-Cl-Ph-	H	H	-COOH	Ph-	^t Bu-
0	3-Cl-Ph-	H	H	-COOH	Ph-	ⁱ Bu-
0	3-Cl-Ph-	H	H	-COOH	Ph-	Cyclopentyl-
0	3-Cl-Ph-	H	H	-COOH	Ph-	Cyclohexyl-
0	3-Cl-Ph-	H	H	-COOH	Ph-	Ph-
0	3-Cl-Ph-	H	H	-COOH	Ph-	2-Pyridyl-
0	3-Cl-Ph-	H	H	-COOH	Ph-	3-Pyridyl-
0	3-Cl-Ph-	H	H	-COOH	Ph-	4-Pyridyl-
0	3-Cl-Ph-	H	H	-COOH	Ph-	2-Furyl-
0	3-Cl-Ph-	H	H	-COOH	Ph-	3-Furyl-
0	3-Cl-Ph-	H	H	-COOH	Ph-	2-Thienyl-
0	3-Cl-Ph-	H	H	-COOH	Ph-	3-Thienyl-
0	3-Cl-Ph-	H	H	-COOH	Ph-	-CH ₂ CN
0	3-Cl-Ph-	H	H	-COOH	Ph-	-CH ₂ CO ₂ Et
0	3-Cl-Ph-	H	H	-COOH	Ph-	-(CH ₂) ₂ OH
0	3-Cl-Ph-	H	H	-COOH	Ph-	-(CH ₂) ₂ OMe
0	3-Cl-Ph-	H	H	-COOH	Ph-	-(CH ₂) ₂ NMe ₂

【表 8 3】

表 83

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
0	4-Cl-Ph-	H	H	-COOH	Ph-	Me-
0	4-Cl-Ph-	H	H	-COOH	Ph-	Et-
0	4-Cl-Ph-	H	H	-COOH	Ph-	ⁿ Pr-
0	4-Cl-Ph-	H	H	-COOH	Ph-	ⁱ Pr-
0	4-Cl-Ph-	H	H	-COOH	Ph-	^t Bu-
0	4-Cl-Ph-	H	H	-COOH	Ph-	ⁱ Bu-
0	4-Cl-Ph-	H	H	-COOH	Ph-	Cyclopentyl-
0	4-Cl-Ph-	H	H	-COOH	Ph-	Cyclohexyl-
0	4-Cl-Ph-	H	H	-COOH	Ph-	Ph-
0	4-Cl-Ph-	H	H	-COOH	Ph-	2-Pyridyl-
0	4-Cl-Ph-	H	H	-COOH	Ph-	3-Pyridyl-
0	4-Cl-Ph-	H	H	-COOH	Ph-	4-Pyridyl-
0	4-Cl-Ph-	H	H	-COOH	Ph-	2-Furyl-
0	4-Cl-Ph-	H	H	-COOH	Ph-	3-Furyl-
0	4-Cl-Ph-	H	H	-COOH	Ph-	2-Thienyl-
0	4-Cl-Ph-	H	H	-COOH	Ph-	3-Thienyl-
0	4-Cl-Ph-	H	H	-COOH	Ph-	-CH ₂ CN
0	4-Cl-Ph-	H	H	-COOH	Ph-	-CH ₂ CO ₂ Et
0	4-Cl-Ph-	H	H	-COOH	Ph-	-(CH ₂) ₂ OH
0	4-Cl-Ph-	H	H	-COOH	Ph-	-(CH ₂) ₂ OMe
0	4-Cl-Ph-	H	H	-COOH	Ph-	-(CH ₂) ₂ NMe ₂

【表 8 4】

表 84

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
0	4-Cl-Ph-	-H	-H	Me-	Ph-	Me-
0	4-Cl-Ph-	-H	-H	Me-	Ph-	Et-
0	4-Cl-Ph-	-H	-H	Me-	Ph-	^t Pr-
0	4-Cl-Ph-	-H	-H	Me-	Ph-	ⁱ Pr-
0	4-Cl-Ph-	-H	-H	Me-	Ph-	^t Bu-
0	4-Cl-Ph-	-H	-H	Me-	Ph-	ⁱ Bu-
0	4-Cl-Ph-	-H	-H	Me-	Ph-	Cyclopentyl-
0	4-Cl-Ph-	-H	-H	Me-	Ph-	Cyclohexyl-
0	4-Cl-Ph-	-H	-H	Me-	Ph-	Ph-
0	4-Cl-Ph-	-H	-H	Me-	Ph-	2-Pyridyl-
0	4-Cl-Ph-	-H	-H	Me-	Ph-	3-Pyridyl-
0	4-Cl-Ph-	-H	-H	Me-	Ph-	4-Pyridyl-
0	4-Cl-Ph-	-H	-H	Me-	Ph-	2-Furyl-
0	4-Cl-Ph-	-H	-H	Me-	Ph-	3-Furyl-
0	4-Cl-Ph-	-H	-H	Me-	Ph-	2-Thienyl-
0	4-Cl-Ph-	-H	-H	Me-	Ph-	3-Thienyl-
0	4-Cl-Ph-	-H	-H	Me-	Ph-	2-Thienyl-
0	4-Cl-Ph-	-H	-H	Me-	Ph-	-CH ₂ CO ₂ Et
0	4-Cl-Ph-	-H	-H	Me-	Ph-	-CH ₂ CO ₂ H
0	4-Cl-Ph-	-H	-H	Me-	Ph-	-(CH ₂) ₂ OH
0	4-Cl-Ph-	-H	-H	Me-	Ph-	-(CH ₂) ₂ OMe
0	4-Cl-Ph-	-H	-H	Me-	Ph-	-(CH ₂) ₂ NMe ₂

【表85】

表 85

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
0	Me-	-H	-H	Me-	Ph-	Me-
0	Me-	-H	-H	Me-	Ph-	Et-
0	Me-	-H	-H	Me-	Ph-	^t Pr-
0	Me-	-H	-H	Me-	Ph-	ⁱ Pr-
0	Me-	-H	-H	Me-	Ph-	^t Bu-
0	Me-	-H	-H	Me-	Ph-	ⁱ Bu-
0	Me-	-H	-H	Me-	Ph-	Cyclopentyl-
0	Me-	-H	-H	Me-	Ph-	Cyclohexyl-
0	Me-	-H	-H	Me-	Ph-	Ph-
0	Me-	-H	-H	Me-	Ph-	2-Pyridyl-
0	Me-	-H	-H	Me-	Ph-	3-Pyridyl-
0	Me-	-H	-H	Me-	Ph-	4-Pyridyl-
0	Me-	-H	-H	Me-	Ph-	2-Furyl-
0	Me-	-H	-H	Me-	Ph-	3-Furyl-
0	Me-	-H	-H	Me-	Ph-	2-Thienyl-
0	Me-	-H	-H	Me-	Ph-	3-Thienyl-
0	Me-	-H	-H	Me-	Ph-	-CH ₂ CO ₂ Et
0	Me-	-H	-H	Me-	Ph-	-CH ₂ CO ₂ H
0	Me-	-H	-H	Me-	Ph-	-(CH ₂) ₂ OH
0	Me-	-H	-H	Me-	Ph-	-(CH ₂) ₂ OMe
0	Me-	-H	-H	Me-	Ph-	-(CH ₂) ₂ NMe ₂

【表86】

表 86

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
0	Ph-	-H	-H	Me-	Ph-	Me-
0	Ph-	-H	-H	Me-	Ph-	Et-
0	Ph-	-H	-H	Me-	Ph-	ⁿ Pr-
0	Ph-	-H	-H	Me-	Ph-	ⁱ Pr-
0	Ph-	-H	-H	Me-	Ph-	ⁿ Bu-
0	Ph-	-H	-H	Me-	Ph-	ⁱ Bu-
0	Ph-	-H	-H	Me-	Ph-	Cyclopentyl-
0	Ph-	-H	-H	Me-	Ph-	Cyclohexyl-
0	Ph-	-H	-H	Me-	Ph-	Ph-
0	Ph-	-H	-H	Me-	Ph-	2-Pyridyl-
0	Ph-	-H	-H	Me-	Ph-	3-Pyridyl-
0	Ph-	-H	-H	Me-	Ph-	4-Pyridyl-
0	Ph-	-H	-H	Me-	Ph-	2-Furyl-
0	Ph-	-H	-H	Me-	Ph-	3-Furyl-
0	Ph-	-H	-H	Me-	Ph-	2-Thienyl-
0	Ph-	-H	-H	Me-	Ph-	3-Thienyl-
0	Ph-	-H	-H	Me-	Ph-	-CH ₂ CN
0	Ph-	-H	-H	Me-	Ph-	-CH ₂ CO ₂ Et
0	Ph-	-H	-H	Me-	Ph-	-CH ₂ CO ₂ H
0	Ph-	-H	-H	Me-	Ph-	-(CH ₂) ₂ OH
0	Ph-	-H	-H	Me-	Ph-	-(CH ₂) ₂ OMe
0	Ph-	-H	-H	Me-	Ph-	-(CH ₂) ₂ NMe ₂

【表 87】

表 87

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
0	2-Me-Ph-	-H	-H	Me-	Ph-	Me-
0	2-Me-Ph-	-H	-H	Me-	Ph-	Et-
0	2-Me-Ph-	-H	-H	Me-	Ph-	ⁿ Pr-
0	2-Me-Ph-	-H	-H	Me-	Ph-	ⁱ Pr-
0	2-Me-Ph-	-H	-H	Me-	Ph-	ⁿ Bu-
0	2-Me-Ph-	-H	-H	Me-	Ph-	ⁱ Bu-
0	2-Me-Ph-	-H	-H	Me-	Ph-	Cyclopentyl-
0	2-Me-Ph-	-H	-H	Me-	Ph-	Cyclohexyl-
0	2-Me-Ph-	-H	-H	Me-	Ph-	Ph-
0	2-Me-Ph-	-H	-H	Me-	Ph-	2-Pyridyl-
0	2-Me-Ph-	-H	-H	Me-	Ph-	3-Pyridyl-
0	2-Me-Ph-	-H	-H	Me-	Ph-	4-Pyridyl-
0	2-Me-Ph-	-H	-H	Me-	Ph-	2-Furyl-
0	2-Me-Ph-	-H	-H	Me-	Ph-	3-Furyl-
0	2-Me-Ph-	-H	-H	Me-	Ph-	2-Thienyl-
0	2-Me-Ph-	-H	-H	Me-	Ph-	3-Thienyl-
0	2-Me-Ph-	-H	-H	Me-	Ph-	-CH ₂ CN
0	2-Me-Ph-	-H	-H	Me-	Ph-	-CH ₂ CO ₂ Et
0	2-Me-Ph-	-H	-H	Me-	Ph-	-CH ₂ CO ₂ H
0	2-Me-Ph-	-H	-H	Me-	Ph-	-(CH ₂) ₂ OH
0	2-Me-Ph-	-H	-H	Me-	Ph-	-(CH ₂) ₂ OMe
0	2-Me-Ph-	-H	-H	Me-	Ph-	-(CH ₂) ₂ NMe ₂

【表 88】

表 88

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
0	4-Me-Ph	-H	-H	Me-	Ph-	Me-
0	4-Me-Ph	-H	-H	Me-	Ph-	Et-
0	4-Me-Ph	-H	-H	Me-	Ph-	ⁿ Pr-
0	4-Me-Ph	-H	-H	Me-	Ph-	ⁱ Pr-
0	4-Me-Ph	-H	-H	Me-	Ph-	ⁿ Bu-
0	4-Me-Ph	-H	-H	Me-	Ph-	ⁱ Bu-
0	4-Me-Ph	-H	-H	Me-	Ph-	Cyclohexyl-
0	4-Me-Ph	-H	-H	Me-	Ph-	Cyclohexyl- Ph-
0	4-Me-Ph	-H	-H	Me-	Ph-	2-Pyridyl-
0	4-Me-Ph	-H	-H	Me-	Ph-	3-Pyridyl-
0	4-Me-Ph	-H	-H	Me-	Ph-	4-Pyridyl-
0	4-Me-Ph	-H	-H	Me-	Ph-	2-Furyl-
0	4-Me-Ph	-H	-H	Me-	Ph-	3-Furyl-
0	4-Me-Ph	-H	-H	Me-	Ph-	2-Thienyl-
0	4-Me-Ph	-H	-H	Me-	Ph-	3-Thienyl-
0	4-Me-Ph	-H	-H	Me-	Ph-	-CH ₂ CO ₂ Et
0	4-Me-Ph	-H	-H	Me-	Ph-	-CH ₂ CO ₂ H
0	4-Me-Ph	-H	-H	Me-	Ph-	-(CH ₂) ₂ OH
0	4-Me-Ph	-H	-H	Me-	Ph-	-(CH ₂) ₂ OMe
0	4-Me-Ph	-H	-H	Me-	Ph-	-(CH ₂) ₂ NMe ₂

【表89】

表 89

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
0	2-Cl-Ph	-H	-H	Me-	Ph-	Me-
0	2-Cl-Ph	-H	-H	Me-	Ph-	Et-
0	2-Cl-Ph	-H	-H	Me-	Ph-	ⁿ Pr-
0	2-Cl-Ph	-H	-H	Me-	Ph-	ⁱ Pr-
0	2-Cl-Ph	-H	-H	Me-	Ph-	ⁿ Bu-
0	2-Cl-Ph	-H	-H	Me-	Ph-	ⁱ Bu-
0	2-Cl-Ph	-H	-H	Me-	Ph-	Cyclohexyl-
0	2-Cl-Ph	-H	-H	Me-	Ph-	Cyclohexyl- Ph-
0	2-Cl-Ph	-H	-H	Me-	Ph-	2-Pyridyl-
0	2-Cl-Ph	-H	-H	Me-	Ph-	3-Pyridyl-
0	2-Cl-Ph	-H	-H	Me-	Ph-	4-Pyridyl-
0	2-Cl-Ph	-H	-H	Me-	Ph-	2-Furyl-
0	2-Cl-Ph	-H	-H	Me-	Ph-	3-Furyl-
0	2-Cl-Ph	-H	-H	Me-	Ph-	2-Thienyl-
0	2-Cl-Ph	-H	-H	Me-	Ph-	3-Thienyl-
0	2-Cl-Ph	-H	-H	Me-	Ph-	-CH ₂ CO ₂ Et
0	2-Cl-Ph	-H	-H	Me-	Ph-	-CH ₂ CO ₂ H
0	2-Cl-Ph	-H	-H	Me-	Ph-	-(CH ₂) ₂ OH
0	2-Cl-Ph	-H	-H	Me-	Ph-	-(CH ₂) ₂ OMe
0	2-Cl-Ph	-H	-H	Me-	Ph-	-(CH ₂) ₂ NMe ₂

【表90】

表 80

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
0	4-O-Ph-	-H	-H	Me-	Ph-	Me-
0	4-O-Ph-	-H	-H	Me-	Ph-	Et-
0	4-O-Ph-	-H	-H	Me-	Ph-	ⁿ Pr-
0	4-O-Ph-	-H	-H	Me-	Ph-	ⁿ Pr-
0	4-O-Ph-	-H	-H	Me-	Ph-	ⁿ Bu-
0	4-O-Ph-	-H	-H	Me-	Ph-	Cyclopentyl-
0	4-O-Ph-	-H	-H	Me-	Ph-	Cyclohexyl-
0	4-O-Ph-	-H	-H	Me-	Ph-	Ph-
0	4-O-Ph-	-H	-H	Me-	Ph-	2-Pyridyl-
0	4-O-Ph-	-H	-H	Me-	Ph-	3-Pyridyl-
0	4-O-Ph-	-H	-H	Me-	Ph-	4-Pyridyl-
0	4-O-Ph-	-H	-H	Me-	Ph-	2-Furyl-
0	4-O-Ph-	-H	-H	Me-	Ph-	3-Furyl-
0	4-O-Ph-	-H	-H	Me-	Ph-	2-Thienyl-
0	4-O-Ph-	-H	-H	Me-	Ph-	3-Thienyl-
0	4-O-Ph-	-H	-H	Me-	Ph-	-CH ₂ CN
0	4-O-Ph-	-H	-H	Me-	Ph-	-CH ₂ CO ₂ Et
0	4-O-Ph-	-H	-H	Me-	Ph-	-CH ₂ CO ₂ H
0	4-O-Ph-	-H	-H	Me-	Ph-	-(CH ₂) ₂ OH
0	4-O-Ph-	-H	-H	Me-	Ph-	-(CH ₂) ₂ OMe
0	4-O-Ph-	-H	-H	Me-	Ph-	-(CH ₂) ₂ NMe ₂

【0032】

【表91】

表 81

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
0	Me-	-H	-H	-H	Cyclohexyl-	Me-
0	Me-	-H	-H	-H	Cyclohexyl-	Et-
0	Me-	-H	-H	-H	Cyclohexyl-	ⁿ Pr-
0	Me-	-H	-H	-H	Cyclohexyl-	ⁿ Pr-
0	Me-	-H	-H	-H	Cyclohexyl-	ⁿ Bu-
0	Me-	-H	-H	-H	Cyclohexyl-	ⁿ Bu-
0	Me-	-H	-H	-H	Cyclohexyl-	Cyclopentyl-
0	Me-	-H	-H	-H	Cyclohexyl-	Cyclohexyl-
0	Me-	-H	-H	-H	Cyclohexyl-	Ph-
0	Me-	-H	-H	-H	Cyclohexyl-	2-Pyridyl-
0	Me-	-H	-H	-H	Cyclohexyl-	3-Pyridyl-
0	Me-	-H	-H	-H	Cyclohexyl-	4-Pyridyl-
0	Me-	-H	-H	-H	Cyclohexyl-	2-Furyl-
0	Me-	-H	-H	-H	Cyclohexyl-	3-Furyl-
0	Me-	-H	-H	-H	Cyclohexyl-	2-Thienyl-
0	Me-	-H	-H	-H	Cyclohexyl-	3-Thienyl-
0	Me-	-H	-H	-H	Cyclohexyl-	-CH ₂ CN
0	Me-	-H	-H	-H	Cyclohexyl-	-CH ₂ CO ₂ Et
0	Me-	-H	-H	-H	Cyclohexyl-	-CH ₂ CO ₂ H
0	Me-	-H	-H	-H	Cyclohexyl-	-(CH ₂) ₂ OH
0	Me-	-H	-H	-H	Cyclohexyl-	-(CH ₂) ₂ OMe
0	Me-	-H	-H	-H	Cyclohexyl-	-(CH ₂) ₂ NMe ₂

【表92】

表 92

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
0	Ph-	H	H	H	Cyclohexyl-	Me-
0	Ph-	H	H	H	Cyclohexyl-	Et-
0	Ph-	H	H	H	Cyclohexyl-	ⁿ Pr-
0	Ph-	H	H	H	Cyclohexyl-	ⁱ Pr-
0	Ph-	H	H	H	Cyclohexyl-	ⁿ Bu-
0	Ph-	H	H	H	Cyclohexyl-	ⁱ Bu-
0	Ph-	H	H	H	Cyclohexyl-	Cyclopentyl-
0	Ph-	H	H	H	Cyclohexyl-	Cyclohexyl-
0	Ph-	H	H	H	Cyclohexyl-	Ph-
0	Ph-	H	H	H	Cyclohexyl-	2-Pyridyl-
0	Ph-	H	H	H	Cyclohexyl-	3-Pyridyl-
0	Ph-	H	H	H	Cyclohexyl-	4-Pyridyl-
0	Ph-	H	H	H	Cyclohexyl-	2-Furyl-
0	Ph-	H	H	H	Cyclohexyl-	3-Furyl-
0	Ph-	H	H	H	Cyclohexyl-	2-Thienyl-
0	Ph-	H	H	H	Cyclohexyl-	3-Thienyl-
0	Ph-	H	H	H	Cyclohexyl-	-CH ₂ CN
0	Ph-	H	H	H	Cyclohexyl-	-CH ₂ CO ₂ Et
0	Ph-	H	H	H	Cyclohexyl-	-CH ₂ CO ₂ H
0	Ph-	H	H	H	Cyclohexyl-	-(CH ₂) ₂ OH
0	Ph-	H	H	H	Cyclohexyl-	-(CH ₂) ₂ OMe
0	Ph-	H	H	H	Cyclohexyl-	-(CH ₂) ₂ NMe ₂

【表93】

表 93

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
0	2-Me-Ph-	H	H	H	Cyclohexyl-	Me-
0	2-Me-Ph-	H	H	H	Cyclohexyl-	Et-
0	2-Me-Ph-	H	H	H	Cyclohexyl-	ⁿ Pr-
0	2-Me-Ph-	H	H	H	Cyclohexyl-	ⁱ Pr-
0	2-Me-Ph-	H	H	H	Cyclohexyl-	ⁿ Bu-
0	2-Me-Ph-	H	H	H	Cyclohexyl-	ⁱ Bu-
0	2-Me-Ph-	H	H	H	Cyclohexyl-	Cyclopentyl-
0	2-Me-Ph-	H	H	H	Cyclohexyl-	Cyclohexyl-
0	2-Me-Ph-	H	H	H	Cyclohexyl-	Ph-
0	2-Me-Ph-	H	H	H	Cyclohexyl-	2-Pyridyl-
0	2-Me-Ph-	H	H	H	Cyclohexyl-	3-Pyridyl-
0	2-Me-Ph-	H	H	H	Cyclohexyl-	4-Pyridyl-
0	2-Me-Ph-	H	H	H	Cyclohexyl-	2-Furyl-
0	2-Me-Ph-	H	H	H	Cyclohexyl-	3-Furyl-
0	2-Me-Ph-	H	H	H	Cyclohexyl-	2-Thienyl-
0	2-Me-Ph-	H	H	H	Cyclohexyl-	3-Thienyl-
0	2-Me-Ph-	H	H	H	Cyclohexyl-	-CH ₂ CN
0	2-Me-Ph-	H	H	H	Cyclohexyl-	-CH ₂ CO ₂ Et
0	2-Me-Ph-	H	H	H	Cyclohexyl-	-CH ₂ CO ₂ H
0	2-Me-Ph-	H	H	H	Cyclohexyl-	-(CH ₂) ₂ OH
0	2-Me-Ph-	H	H	H	Cyclohexyl-	-(CH ₂) ₂ OMe
0	2-Me-Ph-	H	H	H	Cyclohexyl-	-(CH ₂) ₂ NMe ₂

【表94】

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
0	4-Me-Ph	H	H	H	Cyclohexyl-	Me-
0	4-Me-Ph	H	H	H	Cyclohexyl-	Et-
0	4-Me-Ph	H	H	H	Cyclohexyl-	ⁿ Pr-
0	4-Me-Ph	H	H	H	Cyclohexyl-	ⁱ Pr-
0	4-Me-Ph	H	H	H	Cyclohexyl-	ⁿ Bu-
0	4-Me-Ph	H	H	H	Cyclohexyl-	ⁱ Bu-
0	4-Me-Ph	H	H	H	Cyclohexyl-	Cyclopentyl-
0	4-Me-Ph	H	H	H	Cyclohexyl-	Cyclohexyl-
0	4-Me-Ph	H	H	H	Cyclohexyl-	Ph-
0	4-Me-Ph	H	H	H	Cyclohexyl-	2-Pyridyl-
0	4-Me-Ph	H	H	H	Cyclohexyl-	3-Pyridyl-
0	4-Me-Ph	H	H	H	Cyclohexyl-	4-Pyridyl-
0	4-Me-Ph	H	H	H	Cyclohexyl-	2-Furyl-
0	4-Me-Ph	H	H	H	Cyclohexyl-	3-Furyl-
0	4-Me-Ph	H	H	H	Cyclohexyl-	2-Thienyl-
0	4-Me-Ph	H	H	H	Cyclohexyl-	3-Thienyl-
0	4-Me-Ph	H	H	H	Cyclohexyl-	-CH ₂ CN
0	4-Me-Ph	H	H	H	Cyclohexyl-	-CH ₂ CO ₂ Et
0	4-Me-Ph	H	H	H	Cyclohexyl-	-CH ₂ CO ₂ H
0	4-Me-Ph	H	H	H	Cyclohexyl-	-(CH ₂) ₂ OH
0	4-Me-Ph	H	H	H	Cyclohexyl-	-(CH ₂) ₂ OMe
0	4-Me-Ph	H	H	H	Cyclohexyl-	-(CH ₂) ₂ NMe ₂

【表 95】

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
0	2-Cl-Ph	H	H	H	Cyclohexyl-	Me-
0	2-Cl-Ph	H	H	H	Cyclohexyl-	Et-
0	2-Cl-Ph	H	H	H	Cyclohexyl-	ⁿ Pr-
0	2-Cl-Ph	H	H	H	Cyclohexyl-	ⁱ Pr-
0	2-Cl-Ph	H	H	H	Cyclohexyl-	ⁿ Bu-
0	2-Cl-Ph	H	H	H	Cyclohexyl-	ⁱ Bu-
0	2-Cl-Ph	H	H	H	Cyclohexyl-	Cyclopentyl-
0	2-Cl-Ph	H	H	H	Cyclohexyl-	Cyclohexyl-
0	2-Cl-Ph	H	H	H	Cyclohexyl-	Ph-
0	2-Cl-Ph	H	H	H	Cyclohexyl-	2-Pyridyl-
0	2-Cl-Ph	H	H	H	Cyclohexyl-	3-Pyridyl-
0	2-Cl-Ph	H	H	H	Cyclohexyl-	4-Pyridyl-
0	2-Cl-Ph	H	H	H	Cyclohexyl-	2-Furyl-
0	2-Cl-Ph	H	H	H	Cyclohexyl-	3-Furyl-
0	2-Cl-Ph	H	H	H	Cyclohexyl-	2-Thienyl-
0	2-Cl-Ph	H	H	H	Cyclohexyl-	3-Thienyl-
0	2-Cl-Ph	H	H	H	Cyclohexyl-	-CH ₂ CN
0	2-Cl-Ph	H	H	H	Cyclohexyl-	-CH ₂ CO ₂ Et
0	2-Cl-Ph	H	H	H	Cyclohexyl-	-CH ₂ CO ₂ H
0	2-Cl-Ph	H	H	H	Cyclohexyl-	-(CH ₂) ₂ OH
0	2-Cl-Ph	H	H	H	Cyclohexyl-	-(CH ₂) ₂ OMe
0	2-Cl-Ph	H	H	H	Cyclohexyl-	-(CH ₂) ₂ NMe ₂

【表 96】

表 98

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
0	Me-	H	H	H	Me-	Me-
0	Me-	H	H	H	Me-	Et-
0	Me-	H	H	H	Me-	ⁿ Pr-
0	Me-	H	H	H	Me-	ⁱ Pr-
0	Me-	H	H	H	Me-	ⁿ Bu-
0	Me-	H	H	H	Me-	ⁱ Bu-
0	Me-	H	H	H	Me-	Cyclopentyl-
0	Me-	H	H	H	Me-	Cyclohexyl-
0	Me-	H	H	H	Me-	Ph-
0	Me-	H	H	H	Me-	2-Pyridyl-
0	Me-	H	H	H	Me-	3-Pyridyl-
0	Me-	H	H	H	Me-	4-Pyridyl-
0	Me-	H	H	H	Me-	2-Furyl-
0	Me-	H	H	H	Me-	3-Furyl-
0	Me-	H	H	H	Me-	2-Thienyl-
0	Me-	H	H	H	Me-	3-Thienyl-
0	Me-	H	H	H	Me-	-CH ₂ CN
0	Me-	H	H	H	Me-	-CH ₂ CO ₂ Et
0	Me-	H	H	H	Me-	-CH ₂ CO ₂ H
0	Me-	H	H	H	Me-	-(CH ₂) ₂ OH
0	Me-	H	H	H	Me-	-(CH ₂) ₂ OMe
0	Me-	H	H	H	Me-	-(CH ₂) ₂ NMe ₂

【表 97】

表 97

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
0	Ph-	H	H	H	Me-	Me-
0	Ph-	H	H	H	Me-	Et-
0	Ph-	H	H	H	Me-	ⁿ Pr-
0	Ph-	H	H	H	Me-	ⁱ Pr-
0	Ph-	H	H	H	Me-	ⁿ Bu-
0	Ph-	H	H	H	Me-	ⁱ Bu-
0	Ph-	H	H	H	Me-	Cyclopentyl-
0	Ph-	H	H	H	Me-	Cyclohexyl-
0	Ph-	H	H	H	Me-	Ph-
0	Ph-	H	H	H	Me-	2-Pyridyl-
0	Ph-	H	H	H	Me-	3-Pyridyl-
0	Ph-	H	H	H	Me-	4-Pyridyl-
0	Ph-	H	H	H	Me-	2-Furyl-
0	Ph-	H	H	H	Me-	3-Furyl-
0	Ph-	H	H	H	Me-	2-Thienyl-
0	Ph-	H	H	H	Me-	3-Thienyl-
0	Ph-	H	H	H	Me-	-CH ₂ CN
0	Ph-	H	H	H	Me-	-CH ₂ CO ₂ Et
0	Ph-	H	H	H	Me-	-CH ₂ CO ₂ H
0	Ph-	H	H	H	Me-	-(CH ₂) ₂ OH
0	Ph-	H	H	H	Me-	-(CH ₂) ₂ OMe
0	Ph-	H	H	H	Me-	-(CH ₂) ₂ NMe ₂

【表 98】

表 98

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
0	2-Me-Ph-	-H	-H	-H	Me-	Me-
0	2-Me-Ph-	-H	-H	-H	Me-	Et-
0	2-Me-Ph-	-H	-H	-H	Me-	ⁿ Pr-
0	2-Me-Ph-	-H	-H	-H	Me-	ⁱ Pr-
0	2-Me-Ph-	-H	-H	-H	Me-	ⁿ Bu-
0	2-Me-Ph-	-H	-H	-H	Me-	ⁱ Bu-
0	2-Me-Ph-	-H	-H	-H	Me-	Cyclopentyl-
0	2-Me-Ph-	-H	-H	-H	Me-	Cyclohexyl-
0	2-Me-Ph-	-H	-H	-H	Me-	Ph-
0	2-Me-Ph-	-H	-H	-H	Me-	2-Pyridyl-
0	2-Me-Ph-	-H	-H	-H	Me-	3-Pyridyl-
0	2-Me-Ph-	-H	-H	-H	Me-	4-Pyridyl-
0	2-Me-Ph-	-H	-H	-H	Me-	2-Furyl-
0	2-Me-Ph-	-H	-H	-H	Me-	3-Furyl-
0	2-Me-Ph-	-H	-H	-H	Me-	2-Thienyl-
0	2-Me-Ph-	-H	-H	-H	Me-	3-Thienyl-
0	2-Me-Ph-	-H	-H	-H	Me-	-CH ₂ CN
0	2-Me-Ph-	-H	-H	-H	Me-	-CH ₂ CO ₂ Et
0	2-Me-Ph-	-H	-H	-H	Me-	-CH ₂ CO ₂ H
0	2-Me-Ph-	-H	-H	-H	Me-	-(CH ₂) ₂ OH
0	2-Me-Ph-	-H	-H	-H	Me-	-(CH ₂) ₂ OMe
0	2-Me-Ph-	-H	-H	-H	Me-	-(CH ₂) ₂ NMe ₂

【表99】

表 99

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
0	4-Me-Ph-	-H	-H	-H	Me-	Me-
0	4-Me-Ph-	-H	-H	-H	Me-	Et-
0	4-Me-Ph-	-H	-H	-H	Me-	ⁿ Pr-
0	4-Me-Ph-	-H	-H	-H	Me-	ⁱ Pr-
0	4-Me-Ph-	-H	-H	-H	Me-	ⁿ Bu-
0	4-Me-Ph-	-H	-H	-H	Me-	ⁱ Bu-
0	4-Me-Ph-	-H	-H	-H	Me-	Cyclopentyl-
0	4-Me-Ph-	-H	-H	-H	Me-	Cyclohexyl-
0	4-Me-Ph-	-H	-H	-H	Me-	Ph-
0	4-Me-Ph-	-H	-H	-H	Me-	2-Pyridyl-
0	4-Me-Ph-	-H	-H	-H	Me-	3-Pyridyl-
0	4-Me-Ph-	-H	-H	-H	Me-	4-Pyridyl-
0	4-Me-Ph-	-H	-H	-H	Me-	2-Furyl-
0	4-Me-Ph-	-H	-H	-H	Me-	3-Furyl-
0	4-Me-Ph-	-H	-H	-H	Me-	2-Thienyl-
0	4-Me-Ph-	-H	-H	-H	Me-	3-Thienyl-
0	4-Me-Ph-	-H	-H	-H	Me-	-CH ₂ CN
0	4-Me-Ph-	-H	-H	-H	Me-	-CH ₂ CO ₂ Et
0	4-Me-Ph-	-H	-H	-H	Me-	-CH ₂ CO ₂ H
0	4-Me-Ph-	-H	-H	-H	Me-	-(CH ₂) ₂ OH
0	4-Me-Ph-	-H	-H	-H	Me-	-(CH ₂) ₂ OMe
0	4-Me-Ph-	-H	-H	-H	Me-	-(CH ₂) ₂ NMe ₂

【表100】

表 100

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
0	2-Cl-Ph	H	H	H	Me	Me
0	2-Cl-Ph	H	H	H	Me	Et
0	2-Cl-Ph	H	H	H	Me	ⁿ Pr
0	2-Cl-Ph	H	H	H	Me	ⁱ Pr
0	2-Cl-Ph	H	H	H	Me	ⁿ Bu
0	2-Cl-Ph	H	H	H	Me	ⁱ Bu
0	2-Cl-Ph	H	H	H	Me	Cyclopentyl
0	2-Cl-Ph	H	H	H	Me	Cyclohexyl
0	2-Cl-Ph	H	H	H	Me	Ph
0	2-Cl-Ph	H	H	H	Me	2-Pyridyl
0	2-Cl-Ph	H	H	H	Me	3-Pyridyl
0	2-Cl-Ph	H	H	H	Me	4-Pyridyl
0	2-Cl-Ph	H	H	H	Me	2-Furyl
0	2-Cl-Ph	H	H	H	Me	3-Furyl
0	2-Cl-Ph	H	H	H	Me	2-Thienyl
0	2-Cl-Ph	H	H	H	Me	3-Thienyl
0	2-Cl-Ph	H	H	H	Me	-CH ₂ ON
0	2-Cl-Ph	H	H	H	Me	-CH ₂ CO ₂ Et
0	2-Cl-Ph	H	H	H	Me	-CH ₂ CO ₂ H
0	2-Cl-Ph	H	H	H	Me	-(CH ₂) ₂ OH
0	2-Cl-Ph	H	H	H	Me	-(CH ₂) ₂ OMe
0	2-Cl-Ph	H	H	H	Me	-(CH ₂) ₂ NMe ₂

【0033】

【表101】

表 101

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
0	4-Cl-Ph	H	H	H	Me	Me
0	4-Cl-Ph	H	H	H	Me	Et
0	4-Cl-Ph	H	H	H	Me	ⁿ Pr
0	4-Cl-Ph	H	H	H	Me	ⁱ Pr
0	4-Cl-Ph	H	H	H	Me	ⁿ Bu
0	4-Cl-Ph	H	H	H	Me	ⁱ Bu
0	4-Cl-Ph	H	H	H	Me	Cyclopentyl
0	4-Cl-Ph	H	H	H	Me	Cyclohexyl
0	4-Cl-Ph	H	H	H	Me	Ph
0	4-Cl-Ph	H	H	H	Me	2-Pyridyl
0	4-Cl-Ph	H	H	H	Me	3-Pyridyl
0	4-Cl-Ph	H	H	H	Me	4-Pyridyl
0	4-Cl-Ph	H	H	H	Me	2-Furyl
0	4-Cl-Ph	H	H	H	Me	3-Furyl
0	4-Cl-Ph	H	H	H	Me	2-Thienyl
0	4-Cl-Ph	H	H	H	Me	3-Thienyl
0	4-Cl-Ph	H	H	H	Me	-CH ₂ ON
0	4-Cl-Ph	H	H	H	Me	-CH ₂ CO ₂ Et
0	4-Cl-Ph	H	H	H	Me	-CH ₂ CO ₂ H
0	4-Cl-Ph	H	H	H	Me	-(CH ₂) ₂ OH
0	4-Cl-Ph	H	H	H	Me	-(CH ₂) ₂ OMe
0	4-Cl-Ph	H	H	H	Me	-(CH ₂) ₂ NMe ₂

【表102】

表 103

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
0	Me-	H	Et-	H	Ph-	Me-
0	Me-	H	Et-	H	Ph-	Et-
0	Me-	H	Et-	H	Ph-	ⁿ Pr-
0	Me-	H	Et-	H	Ph-	ⁱ Pr-
0	Me-	H	Et-	H	Ph-	ⁿ Bu-
0	Me-	H	Et-	H	Ph-	ⁱ Bu-
0	Me-	H	Et-	H	Ph-	Cyclopentyl-
0	Me-	H	Et-	H	Ph-	Cyclohexyl-
0	Me-	H	Et-	H	Ph-	Ph-
0	Me-	H	Et-	H	Ph-	2-Pyridyl-
0	Me-	H	Et-	H	Ph-	3-Pyridyl-
0	Me-	H	Et-	H	Ph-	4-Pyridyl-
0	Me-	H	Et-	H	Ph-	2-Furyl-
0	Me-	H	Et-	H	Ph-	3-Furyl-
0	Me-	H	Et-	H	Ph-	2-Thienyl-
0	Me-	H	Et-	H	Ph-	3-Thienyl-
0	Me-	H	Et-	H	Ph-	-CH ₂ CN
0	Me-	H	Et-	H	Ph-	-CH ₂ CO ₂ Et
0	Me-	H	Et-	H	Ph-	-CH ₂ CO ₂ H
0	Me-	H	Et-	H	Ph-	-(CH ₂) ₂ OH
0	Me-	H	Et-	H	Ph-	-(CH ₂) ₂ OMe
0	Me-	H	Et-	H	Ph-	-(CH ₂) ₂ NMe ₂

【表103】

表 104

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
0	Ph-	H	Et-	H	Ph-	Me-
0	Ph-	H	Et-	H	Ph-	Et-
0	Ph-	H	Et-	H	Ph-	ⁿ Pr-
0	Ph-	H	Et-	H	Ph-	ⁱ Pr-
0	Ph-	H	Et-	H	Ph-	ⁿ Bu-
0	Ph-	H	Et-	H	Ph-	ⁱ Bu-
0	Ph-	H	Et-	H	Ph-	Cyclopentyl-
0	Ph-	H	Et-	H	Ph-	Cyclohexyl-
0	Ph-	H	Et-	H	Ph-	Ph-
0	Ph-	H	Et-	H	Ph-	2-Pyridyl-
0	Ph-	H	Et-	H	Ph-	3-Pyridyl-
0	Ph-	H	Et-	H	Ph-	4-Pyridyl-
0	Ph-	H	Et-	H	Ph-	2-Furyl-
0	Ph-	H	Et-	H	Ph-	3-Furyl-
0	Ph-	H	Et-	H	Ph-	2-Thienyl-
0	Ph-	H	Et-	H	Ph-	3-Thienyl-
0	Ph-	H	Et-	H	Ph-	-CH ₂ CN
0	Ph-	H	Et-	H	Ph-	-CH ₂ CO ₂ Et
0	Ph-	H	Et-	H	Ph-	-CH ₂ CO ₂ H
0	Ph-	H	Et-	H	Ph-	-(CH ₂) ₂ OH
0	Ph-	H	Et-	H	Ph-	-(CH ₂) ₂ OMe
0	Ph-	H	Et-	H	Ph-	-(CH ₂) ₂ NMe ₂

【表104】

表 104

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
0	2-Me-Ph-	H	Et-	H	Ph-	Me-
0	2-Me-Ph-	H	Et-	H	Ph-	Et-
0	2-Me-Ph-	H	Et-	H	Ph-	Pr-
0	2-Me-Ph-	H	Et-	H	Ph-	Pr-
0	2-Me-Ph-	H	Et-	H	Ph-	ⁿ Bu-
0	2-Me-Ph-	H	Et-	H	Ph-	ⁱ Bu-
0	2-Me-Ph-	H	Et-	H	Ph-	Cyclopentyl-
0	2-Me-Ph-	H	Et-	H	Ph-	Cyclohexyl-
0	2-Me-Ph-	H	Et-	H	Ph-	Ph-
0	2-Me-Ph-	H	Et-	H	Ph-	2-Pyridyl-
0	2-Me-Ph-	H	Et-	H	Ph-	3-Pyridyl-
0	2-Me-Ph-	H	Et-	H	Ph-	4-Pyridyl-
0	2-Me-Ph-	H	Et-	H	Ph-	2-Furyl-
0	2-Me-Ph-	H	Et-	H	Ph-	3-Furyl-
0	2-Me-Ph-	H	Et-	H	Ph-	2-Thienyl-
0	2-Me-Ph-	H	Et-	H	Ph-	3-Thienyl-
0	2-Me-Ph-	H	Et-	H	Ph-	-CH ₂ CN
0	2-Me-Ph-	H	Et-	H	Ph-	-CH ₂ CO ₂ Et
0	2-Me-Ph-	H	Et-	H	Ph-	-CH ₂ CO ₂ H
0	2-Me-Ph-	H	Et-	H	Ph-	-(CH ₂) ₂ OH
0	2-Me-Ph-	H	Et-	H	Ph-	-(CH ₂) ₂ OMe
0	2-Me-Ph-	H	Et-	H	Ph-	-(CH ₂) ₂ NMe ₂

【表105】

【表106】

表 105

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
0	4-Me-Ph-	H	Et-	H	Ph-	Me-
0	4-Me-Ph-	H	Et-	H	Ph-	Et-
0	4-Me-Ph-	H	Et-	H	Ph-	ⁿ Pr-
0	4-Me-Ph-	H	Et-	H	Ph-	ⁱ Pr-
0	4-Me-Ph-	H	Et-	H	Ph-	ⁿ Bu-
0	4-Me-Ph-	H	Et-	H	Ph-	ⁱ Bu-
0	4-Me-Ph-	H	Et-	H	Ph-	Cyclopentyl-
0	4-Me-Ph-	H	Et-	H	Ph-	Cyclohexyl-
0	4-Me-Ph-	H	Et-	H	Ph-	Ph-
0	4-Me-Ph-	H	Et-	H	Ph-	2-Pyridyl-
0	4-Me-Ph-	H	Et-	H	Ph-	3-Pyridyl-
0	4-Me-Ph-	H	Et-	H	Ph-	4-Pyridyl-
0	4-Me-Ph-	H	Et-	H	Ph-	2-Furyl-
0	4-Me-Ph-	H	Et-	H	Ph-	3-Furyl-
0	4-Me-Ph-	H	Et-	H	Ph-	2-Thienyl-
0	4-Me-Ph-	H	Et-	H	Ph-	3-Thienyl-
0	4-Me-Ph-	H	Et-	H	Ph-	-CH ₂ CN
0	4-Me-Ph-	H	Et-	H	Ph-	-CH ₂ CO ₂ Et
0	4-Me-Ph-	H	Et-	H	Ph-	-CH ₂ CO ₂ H
0	4-Me-Ph-	H	Et-	H	Ph-	-(CH ₂) ₂ OH
0	4-Me-Ph-	H	Et-	H	Ph-	-(CH ₂) ₂ OMe
0	4-Me-Ph-	H	Et-	H	Ph-	-(CH ₂) ₂ NMe ₂

表 108

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
0	2-Cl-Ph-	H	Et-	H	Ph-	Me-
0	2-Cl-Ph-	H	Et-	H	Ph-	Et-
0	2-Cl-Ph-	H	Et-	H	Ph-	Pr-
0	2-Cl-Ph-	H	Et-	H	Ph-	Pr-
0	2-Cl-Ph-	H	Et-	H	Ph-	ⁿ Bu-
0	2-Cl-Ph-	H	Et-	H	Ph-	ⁿ Bu-
0	2-Cl-Ph-	H	Et-	H	Ph-	Cyclopentyl-
0	2-Cl-Ph-	H	Et-	H	Ph-	Cyclohexyl-
0	2-Cl-Ph-	H	Et-	H	Ph-	Ph-
0	2-Cl-Ph-	H	Et-	H	Ph-	2-Pyridyl-
0	2-Cl-Ph-	H	Et-	H	Ph-	3-Pyridyl-
0	2-Cl-Ph-	H	Et-	H	Ph-	4-Pyridyl-
0	2-Cl-Ph-	H	Et-	H	Ph-	2-Furyl-
0	2-Cl-Ph-	H	Et-	H	Ph-	3-Furyl-
0	2-Cl-Ph-	H	Et-	H	Ph-	2-Thienyl-
0	2-Cl-Ph-	H	Et-	H	Ph-	3-Thienyl-
0	2-Cl-Ph-	H	Et-	H	Ph-	-CH ₂ ON
0	2-Cl-Ph-	H	Et-	H	Ph-	-CH ₂ CO ₂ Et
0	2-Cl-Ph-	H	Et-	H	Ph-	-CH ₂ CO ₂ H
0	2-Cl-Ph-	H	Et-	H	Ph-	-(CH ₂) ₂ OH
0	2-Cl-Ph-	H	Et-	H	Ph-	-(CH ₂) ₂ OMe
0	2-Cl-Ph-	H	Et-	H	Ph-	-(CH ₂) ₂ NMe ₂

【表107】

表 107

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
0	4-Cl-Ph-	H	Et-	H	Ph-	Me-
0	4-Cl-Ph-	H	Et-	H	Ph-	Et-
0	4-Cl-Ph-	H	Et-	H	Ph-	Pr-
0	4-Cl-Ph-	H	Et-	H	Ph-	Pr-
0	4-Cl-Ph-	H	Et-	H	Ph-	ⁿ Bu-
0	4-Cl-Ph-	H	Et-	H	Ph-	ⁿ Bu-
0	4-Cl-Ph-	H	Et-	H	Ph-	Cyclopentyl-
0	4-Cl-Ph-	H	Et-	H	Ph-	Cyclohexyl-
0	4-Cl-Ph-	H	Et-	H	Ph-	Ph-
0	4-Cl-Ph-	H	Et-	H	Ph-	2-Pyridyl-
0	4-Cl-Ph-	H	Et-	H	Ph-	3-Pyridyl-
0	4-Cl-Ph-	H	Et-	H	Ph-	4-Pyridyl-
0	4-Cl-Ph-	H	Et-	H	Ph-	2-Furyl-
0	4-Cl-Ph-	H	Et-	H	Ph-	3-Furyl-
0	4-Cl-Ph-	H	Et-	H	Ph-	2-Thienyl-
0	4-Cl-Ph-	H	Et-	H	Ph-	3-Thienyl-
0	4-Cl-Ph-	H	Et-	H	Ph-	-CH ₂ ON
0	4-Cl-Ph-	H	Et-	H	Ph-	-CH ₂ CO ₂ Et
0	4-Cl-Ph-	H	Et-	H	Ph-	-CH ₂ CO ₂ H
0	4-Cl-Ph-	H	Et-	H	Ph-	-(CH ₂) ₂ OH
0	4-Cl-Ph-	H	Et-	H	Ph-	-(CH ₂) ₂ OMe
0	4-Cl-Ph-	H	Et-	H	Ph-	-(CH ₂) ₂ NMe ₂

【表108】

表 108

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
0	Me-	Et-	H-	H-	Ph-	Me-
0	Me-	Et-	H-	H-	Ph-	Et-
0	Me-	Et-	H-	H-	Ph-	ⁿ Pr-
0	Me-	Et-	H-	H-	Ph-	ⁱ Pr-
0	Me-	Et-	H-	H-	Ph-	ⁿ Bu-
0	Me-	Et-	H-	H-	Ph-	ⁱ Bu-
0	Me-	Et-	H-	H-	Ph-	Cyclopentyl-
0	Me-	Et-	H-	H-	Ph-	Cyclohexyl-
0	Me-	Et-	H-	H-	Ph-	Ph-
0	Me-	Et-	H-	H-	Ph-	2-Pyridyl-
0	Me-	Et-	H-	H-	Ph-	3-Pyridyl-
0	Me-	Et-	H-	H-	Ph-	4-Pyridyl-
0	Me-	Et-	H-	H-	Ph-	2-Furyl-
0	Me-	Et-	H-	H-	Ph-	3-Furyl-
0	Me-	Et-	H-	H-	Ph-	2-Thienyl-
0	Me-	Et-	H-	H-	Ph-	3-Thienyl-
0	Me-	Et-	H-	H-	Ph-	-CH ₂ ON
0	Me-	Et-	H-	H-	Ph-	-CH ₂ CO ₂ Et
0	Me-	Et-	H-	H-	Ph-	-CH ₂ CO ₂ H
0	Me-	Et-	H-	H-	Ph-	-(CH ₂) ₂ OH
0	Me-	Et-	H-	H-	Ph-	-(CH ₂) ₂ OMe
0	Me-	Et-	H-	H-	Ph-	-(CH ₂) ₂ NMe ₂

【表 109】

表 109

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
0	Ph-	Et-	H-	H-	Ph-	Me-
0	Ph-	Et-	H-	H-	Ph-	Et-
0	Ph-	Et-	H-	H-	Ph-	ⁿ Pr-
0	Ph-	Et-	H-	H-	Ph-	ⁱ Pr-
0	Ph-	Et-	H-	H-	Ph-	ⁿ Bu-
0	Ph-	Et-	H-	H-	Ph-	ⁱ Bu-
0	Ph-	Et-	H-	H-	Ph-	Cyclopentyl-
0	Ph-	Et-	H-	H-	Ph-	Cyclohexyl-
0	Ph-	Et-	H-	H-	Ph-	Ph-
0	Ph-	Et-	H-	H-	Ph-	2-Pyridyl-
0	Ph-	Et-	H-	H-	Ph-	3-Pyridyl-
0	Ph-	Et-	H-	H-	Ph-	4-Pyridyl-
0	Ph-	Et-	H-	H-	Ph-	2-Furyl-
0	Ph-	Et-	H-	H-	Ph-	3-Furyl-
0	Ph-	Et-	H-	H-	Ph-	2-Thienyl-
0	Ph-	Et-	H-	H-	Ph-	3-Thienyl-
0	Ph-	Et-	H-	H-	Ph-	-CH ₂ ON
0	Ph-	Et-	H-	H-	Ph-	-CH ₂ CO ₂ Et
0	Ph-	Et-	H-	H-	Ph-	-CH ₂ CO ₂ H
0	Ph-	Et-	H-	H-	Ph-	-(CH ₂) ₂ OH
0	Ph-	Et-	H-	H-	Ph-	-(CH ₂) ₂ OMe
0	Ph-	Et-	H-	H-	Ph-	-(CH ₂) ₂ NMe ₂

【表 110】

表 110

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
0	2-Me-Ph-	Et-	H-	H-	Ph-	Me-
0	2-Me-Ph-	Et-	H-	H-	Ph-	Et-
0	2-Me-Ph-	Et-	H-	H-	Ph-	ⁿ Pr-
0	2-Me-Ph-	Et-	H-	H-	Ph-	ⁱ Pr-
0	2-Me-Ph-	Et-	H-	H-	Ph-	ⁿ Bu-
0	2-Me-Ph-	Et-	H-	H-	Ph-	ⁱ Bu-
0	2-Me-Ph-	Et-	H-	H-	Ph-	Cyclopentyl-
0	2-Me-Ph-	Et-	H-	H-	Ph-	Cyclohexyl-
0	2-Me-Ph-	Et-	H-	H-	Ph-	Ph-
0	2-Me-Ph-	Et-	H-	H-	Ph-	2-Pyridyl-
0	2-Me-Ph-	Et-	H-	H-	Ph-	3-Pyridyl-
0	2-Me-Ph-	Et-	H-	H-	Ph-	4-Pyridyl-
0	2-Me-Ph-	Et-	H-	H-	Ph-	2-Furyl-
0	2-Me-Ph-	Et-	H-	H-	Ph-	3-Furyl-
0	2-Me-Ph-	Et-	H-	H-	Ph-	2-Thienyl-
0	2-Me-Ph-	Et-	H-	H-	Ph-	3-Thienyl-
0	2-Me-Ph-	Et-	H-	H-	Ph-	-CH ₂ CN
0	2-Me-Ph-	Et-	H-	H-	Ph-	-CH ₂ CO ₂ Et
0	2-Me-Ph-	Et-	H-	H-	Ph-	-CH ₂ CO ₂ H
0	2-Me-Ph-	Et-	H-	H-	Ph-	-(CH ₂) ₂ OH
0	2-Me-Ph-	Et-	H-	H-	Ph-	-(CH ₂) ₂ OMe
0	2-Me-Ph-	Et-	H-	H-	Ph-	-(CH ₂) ₂ NMe ₂

[0034]

[表 111]

表 111

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
0	4-Cl-Ph-	H-	H-	H-	Cyclohexyl-	Me-
0	4-Cl-Ph-	H-	H-	H-	Cyclohexyl-	Et-
0	4-Cl-Ph-	H-	H-	H-	Cyclohexyl-	ⁿ Pr-
0	4-Cl-Ph-	H-	H-	H-	Cyclohexyl-	ⁱ Pr-
0	4-Cl-Ph-	H-	H-	H-	Cyclohexyl-	ⁿ Bu-
0	4-Cl-Ph-	H-	H-	H-	Cyclohexyl-	ⁱ Bu-
0	4-Cl-Ph-	H-	H-	H-	Cyclohexyl-	Cyclopentyl-
0	4-Cl-Ph-	H-	H-	H-	Cyclohexyl-	Cyclohexyl-
0	4-Cl-Ph-	H-	H-	H-	Cyclohexyl-	Ph-
0	4-Cl-Ph-	H-	H-	H-	Cyclohexyl-	2-Pyridyl-
0	4-Cl-Ph-	H-	H-	H-	Cyclohexyl-	3-Pyridyl-
0	4-Cl-Ph-	H-	H-	H-	Cyclohexyl-	4-Pyridyl-
0	4-Cl-Ph-	H-	H-	H-	Cyclohexyl-	2-Furyl-
0	4-Cl-Ph-	H-	H-	H-	Cyclohexyl-	3-Furyl-
0	4-Cl-Ph-	H-	H-	H-	Cyclohexyl-	2-Thienyl-
0	4-Cl-Ph-	H-	H-	H-	Cyclohexyl-	3-Thienyl-
0	4-Cl-Ph-	H-	H-	H-	Cyclohexyl-	-CH ₂ CN
0	4-Cl-Ph-	H-	H-	H-	Cyclohexyl-	-CH ₂ CO ₂ Et
0	4-Cl-Ph-	H-	H-	H-	Cyclohexyl-	-CH ₂ CO ₂ H
0	4-Cl-Ph-	H-	H-	H-	Cyclohexyl-	-(CH ₂) ₂ OH
0	4-Cl-Ph-	H-	H-	H-	Cyclohexyl-	-(CH ₂) ₂ OMe
0	4-Cl-Ph-	H-	H-	H-	Cyclohexyl-	-(CH ₂) ₂ NMe ₂

[表 112]

表 113

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
0	4-Me-Ph-	Et-	H-	H-	Ph-	Me-
0	4-Me-Ph-	Et-	H-	H-	Ph-	Et-
0	4-Me-Ph-	Et-	H-	H-	Ph-	Pr-
0	4-Me-Ph-	Et-	H-	H-	Ph-	Pr-
0	4-Me-Ph-	Et-	H-	H-	Ph-	ⁿ Bu-
0	4-Me-Ph-	Et-	H-	H-	Ph-	ⁱ Bu-
0	4-Me-Ph-	Et-	H-	H-	Ph-	Cyclohexyl-
0	4-Me-Ph-	Et-	H-	H-	Ph-	Cyclohexyl-
0	4-Me-Ph-	Et-	H-	H-	Ph-	Ph-
0	4-Me-Ph-	Et-	H-	H-	Ph-	2-Pyridyl-
0	4-Me-Ph-	Et-	H-	H-	Ph-	3-Pyridyl-
0	4-Me-Ph-	Et-	H-	H-	Ph-	4-Pyridyl-
0	4-Me-Ph-	Et-	H-	H-	Ph-	2-Furyl-
0	4-Me-Ph-	Et-	H-	H-	Ph-	3-Furyl-
0	4-Me-Ph-	Et-	H-	H-	Ph-	2-Thienyl-
0	4-Me-Ph-	Et-	H-	H-	Ph-	3-Thienyl-
0	4-Me-Ph-	Et-	H-	H-	Ph-	-CH ₂ CN
0	4-Me-Ph-	Et-	H-	H-	Ph-	-CH ₂ CO ₂ Et
0	4-Me-Ph-	Et-	H-	H-	Ph-	-CH ₂ CO ₂ H
0	4-Me-Ph-	Et-	H-	H-	Ph-	-(CH ₂) ₂ OH
0	4-Me-Ph-	Et-	H-	H-	Ph-	-(CH ₂) ₂ OMe
0	4-Me-Ph-	Et-	H-	H-	Ph-	-(CH ₂) ₂ NMe ₂

【表 113】

表 113

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
0	2-Cl-Ph-	Et-	H-	H-	Ph-	Me-
0	2-Cl-Ph-	Et-	H-	H-	Ph-	Et-
0	2-Cl-Ph-	Et-	H-	H-	Ph-	Pr-
0	2-Cl-Ph-	Et-	H-	H-	Ph-	Pr-
0	2-Cl-Ph-	Et-	H-	H-	Ph-	ⁿ Bu-
0	2-Cl-Ph-	Et-	H-	H-	Ph-	ⁱ Bu-
0	2-Cl-Ph-	Et-	H-	H-	Ph-	Cyclohexyl-
0	2-Cl-Ph-	Et-	H-	H-	Ph-	Cyclohexyl-
0	2-Cl-Ph-	Et-	H-	H-	Ph-	Ph-
0	2-Cl-Ph-	Et-	H-	H-	Ph-	2-Pyridyl-
0	2-Cl-Ph-	Et-	H-	H-	Ph-	3-Pyridyl-
0	2-Cl-Ph-	Et-	H-	H-	Ph-	4-Pyridyl-
0	2-Cl-Ph-	Et-	H-	H-	Ph-	2-Furyl-
0	2-Cl-Ph-	Et-	H-	H-	Ph-	3-Furyl-
0	2-Cl-Ph-	Et-	H-	H-	Ph-	2-Thienyl-
0	2-Cl-Ph-	Et-	H-	H-	Ph-	3-Thienyl-
0	2-Cl-Ph-	Et-	H-	H-	Ph-	-CH ₂ CN
0	2-Cl-Ph-	Et-	H-	H-	Ph-	-CH ₂ CO ₂ Et
0	2-Cl-Ph-	Et-	H-	H-	Ph-	-CH ₂ CO ₂ H
0	2-Cl-Ph-	Et-	H-	H-	Ph-	-(CH ₂) ₂ OH
0	2-Cl-Ph-	Et-	H-	H-	Ph-	-(CH ₂) ₂ OMe
0	2-Cl-Ph-	Et-	H-	H-	Ph-	-(CH ₂) ₂ NMe ₂

【表 114】

表 114

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
0	4-Cl-Ph-	Et-	H	H	Ph-	Me-
0	4-Cl-Ph-	Et-	H	H	Ph-	Et-
0	4-Cl-Ph-	Et-	H	H	Ph-	ⁿ Pr-
0	4-Cl-Ph-	Et-	H	H	Ph-	ⁱ Pr-
0	4-Cl-Ph-	Et-	H	H	Ph-	ⁿ Bu-
0	4-Cl-Ph-	Et-	H	H	Ph-	ⁱ Bu-
0	4-Cl-Ph-	Et-	H	H	Ph-	Cyclopentyl-
0	4-Cl-Ph-	Et-	H	H	Ph-	Cyclohexyl-
0	4-Cl-Ph-	Et-	H	H	Ph-	Ph-
0	4-Cl-Ph-	Et-	H	H	Ph-	2-Pyridyl-
0	4-Cl-Ph-	Et-	H	H	Ph-	3-Pyridyl-
0	4-Cl-Ph-	Et-	H	H	Ph-	4-Pyridyl-
0	4-Cl-Ph-	Et-	H	H	Ph-	2-Furyl-
0	4-Cl-Ph-	Et-	H	H	Ph-	3-Furyl-
0	4-Cl-Ph-	Et-	H	H	Ph-	2-Thienyl-
0	4-Cl-Ph-	Et-	H	H	Ph-	3-Thienyl-
0	4-Cl-Ph-	Et-	H	H	Ph-	-CH ₂ CN
0	4-Cl-Ph-	Et-	H	H	Ph-	-CH ₂ CO ₂ Et
0	4-Cl-Ph-	Et-	H	H	Ph-	-CH ₂ CO ₂ H
0	4-Cl-Ph-	Et-	H	H	Ph-	-(CH ₂) ₂ OH
0	4-Cl-Ph-	Et-	H	H	Ph-	-(CH ₂) ₂ OMe
0	4-Cl-Ph-	Et-	H	H	Ph-	-(CH ₂) ₂ NMe ₂

【表 115】

【表 116】

表 115

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
S	Me-	H	H	-CN	Ph-	Me-
S	Me-	H	H	-CN	Ph-	Et-
S	Me-	H	H	-CN	Ph-	ⁿ Pr-
S	Me-	H	H	-CN	Ph-	ⁱ Pr-
S	Me-	H	H	-CN	Ph-	ⁿ Bu-
S	Me-	H	H	-CN	Ph-	ⁱ Bu-
S	Me-	H	H	-CN	Ph-	Cyclopentyl-
S	Me-	H	H	-CN	Ph-	Cyclohexyl-
S	Me-	H	H	-CN	Ph-	Ph-
S	Me-	H	H	-CN	Ph-	2-Pyridyl-
S	Me-	H	H	-CN	Ph-	3-Pyridyl-
S	Me-	H	H	-CN	Ph-	4-Pyridyl-
S	Me-	H	H	-CN	Ph-	2-Furyl-
S	Me-	H	H	-CN	Ph-	3-Furyl-
S	Me-	H	H	-CN	Ph-	2-Thienyl-
S	Me-	H	H	-CN	Ph-	3-Thienyl-
S	Me-	H	H	-CN	Ph-	-CH ₂ CN
S	Me-	H	H	-CN	Ph-	-CH ₂ CO ₂ Et
S	Me-	H	H	-CN	Ph-	-CH ₂ CO ₂ H
S	Me-	H	H	-CN	Ph-	-(CH ₂) ₂ OH
S	Me-	H	H	-CN	Ph-	-(CH ₂) ₂ OMe
S	Me-	H	H	-CN	Ph-	-(CH ₂) ₂ NMe ₂

表 116

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
S	Ph-	H	H	-CN	Ph-	Me-
S	Ph-	H	H	-CN	Ph-	Et-
S	Ph-	H	H	-CN	Ph-	ⁿ Pr-
S	Ph-	H	H	-CN	Ph-	ⁱ Pr-
S	Ph-	H	H	-CN	Ph-	ⁿ Bu-
S	Ph-	H	H	-CN	Ph-	ⁱ Bu-
S	Ph-	H	H	-CN	Ph-	Cyclopentyl-
S	Ph-	H	H	-CN	Ph-	Cyclohexyl-
S	Ph-	H	H	-CN	Ph-	Ph-
S	Ph-	H	H	-CN	Ph-	2-Pyridyl-
S	Ph-	H	H	-CN	Ph-	3-Pyridyl-
S	Ph-	H	H	-CN	Ph-	4-Pyridyl-
S	Ph-	H	H	-CN	Ph-	2-Furyl-
S	Ph-	H	H	-CN	Ph-	3-Furyl-
S	Ph-	H	H	-CN	Ph-	2-Thienyl-
S	Ph-	H	H	-CN	Ph-	3-Thienyl-
S	Ph-	H	H	-CN	Ph-	-CH ₂ CN
S	Ph-	H	H	-CN	Ph-	-CH ₂ CO ₂ Et
S	Ph-	H	H	-CN	Ph-	-CH ₂ CO ₂ H
S	Ph-	H	H	-CN	Ph-	-(CH ₂) ₂ OH
S	Ph-	H	H	-CN	Ph-	-(CH ₂) ₂ OMe
S	Ph-	H	H	-CN	Ph-	-(CH ₂) ₂ NMe ₂

【表 117】

表 117

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
S	2-Me-Ph-	H	H	-CN	Ph-	Me-
S	2-Me-Ph-	H	H	-CN	Ph-	Et-
S	2-Me-Ph-	H	H	-CN	Ph-	ⁿ Pr-
S	2-Me-Ph-	H	H	-CN	Ph-	ⁱ Pr-
S	2-Me-Ph-	H	H	-CN	Ph-	ⁿ Bu-
S	2-Me-Ph-	H	H	-CN	Ph-	ⁱ Bu-
S	2-Me-Ph-	H	H	-CN	Ph-	Cyclopentyl-
S	2-Me-Ph-	H	H	-CN	Ph-	Cyclohexyl-
S	2-Me-Ph-	H	H	-CN	Ph-	Ph-
S	2-Me-Ph-	H	H	-CN	Ph-	2-Pyridyl-
S	2-Me-Ph-	H	H	-CN	Ph-	3-Pyridyl-
S	2-Me-Ph-	H	H	-CN	Ph-	4-Pyridyl-
S	2-Me-Ph-	H	H	-CN	Ph-	2-Furyl-
S	2-Me-Ph-	H	H	-CN	Ph-	3-Furyl-
S	2-Me-Ph-	H	H	-CN	Ph-	2-Thienyl-
S	2-Me-Ph-	H	H	-CN	Ph-	3-Thienyl-
S	2-Me-Ph-	H	H	-CN	Ph-	-CH ₂ CN
S	2-Me-Ph-	H	H	-CN	Ph-	-CH ₂ CO ₂ Et
S	2-Me-Ph-	H	H	-CN	Ph-	-CH ₂ CO ₂ H
S	2-Me-Ph-	H	H	-CN	Ph-	-(CH ₂) ₂ OH
S	2-Me-Ph-	H	H	-CN	Ph-	-(CH ₂) ₂ OMe
S	2-Me-Ph-	H	H	-CN	Ph-	-(CH ₂) ₂ NMe ₂

【表 118】

表 118

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
S	4-Me-Ph	H	H	-CN	Ph	Me
S	4-Me-Ph	H	H	-CN	Ph	Et
S	4-Me-Ph	H	H	-CN	Ph	Pr
S	4-Me-Ph	H	H	-CN	Ph	Pr
S	4-Me-Ph	H	H	-CN	Ph	ⁿ Bu
S	4-Me-Ph	H	H	-CN	Ph	ⁿ Bu
S	4-Me-Ph	H	H	-CN	Ph	Cyclopentyl
S	4-Me-Ph	H	H	-CN	Ph	Cyclohexyl
S	4-Me-Ph	H	H	-CN	Ph	Ph
S	4-Me-Ph	H	H	-CN	Ph	2-Pyridyl
S	4-Me-Ph	H	H	-CN	Ph	3-Pyridyl
S	4-Me-Ph	H	H	-CN	Ph	4-Pyridyl
S	4-Me-Ph	H	H	-CN	Ph	2-Furyl
S	4-Me-Ph	H	H	-CN	Ph	3-Furyl
S	4-Me-Ph	H	H	-CN	Ph	2-Thienyl
S	4-Me-Ph	H	H	-CN	Ph	3-Thienyl
S	4-Me-Ph	H	H	-CN	Ph	-CH ₂ CN
S	4-Me-Ph	H	H	-CN	Ph	-CH ₂ CO ₂ Et
S	4-Me-Ph	H	H	-CN	Ph	-CH ₂ CO ₂ H
S	4-Me-Ph	H	H	-CN	Ph	-(CH ₂) ₂ OH
S	4-Me-Ph	H	H	-CN	Ph	-(CH ₂) ₂ OMe
S	4-Me-Ph	H	H	-CN	Ph	-(CH ₂) ₂ NMe ₂

【表 119】

表 119

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
S	2-Cl-Ph	H	H	-CN	Ph	Me
S	2-Cl-Ph	H	H	-CN	Ph	Et
S	2-Cl-Ph	H	H	-CN	Ph	Pr
S	2-Cl-Ph	H	H	-CN	Ph	Pr
S	2-Cl-Ph	H	H	-CN	Ph	ⁿ Bu
S	2-Cl-Ph	H	H	-CN	Ph	ⁿ Bu
S	2-Cl-Ph	H	H	-CN	Ph	Cyclopentyl
S	2-Cl-Ph	H	H	-CN	Ph	Cyclohexyl
S	2-Cl-Ph	H	H	-CN	Ph	Ph
S	2-Cl-Ph	H	H	-CN	Ph	2-Pyridyl
S	2-Cl-Ph	H	H	-CN	Ph	3-Pyridyl
S	2-Cl-Ph	H	H	-CN	Ph	4-Pyridyl
S	2-Cl-Ph	H	H	-CN	Ph	2-Furyl
S	2-Cl-Ph	H	H	-CN	Ph	3-Furyl
S	2-Cl-Ph	H	H	-CN	Ph	2-Thienyl
S	2-Cl-Ph	H	H	-CN	Ph	3-Thienyl
S	2-Cl-Ph	H	H	-CN	Ph	-CH ₂ CN
S	2-Cl-Ph	H	H	-CN	Ph	-CH ₂ CO ₂ Et
S	2-Cl-Ph	H	H	-CN	Ph	-CH ₂ CO ₂ H
S	2-Cl-Ph	H	H	-CN	Ph	-(CH ₂) ₂ OH
S	2-Cl-Ph	H	H	-CN	Ph	-(CH ₂) ₂ OMe
S	2-Cl-Ph	H	H	-CN	Ph	-(CH ₂) ₂ NMe ₂

【表 120】

表 120

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
S	4-Cl-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	Me-
S	4-Cl-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	Et-
S	4-Cl-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	ⁿ Pr-
S	4-Cl-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	ⁿ Pr-
S	4-Cl-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	ⁿ Bu-
S	4-Cl-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	ⁿ Bu-
S	4-Cl-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	Cyclopentyl-
S	4-Cl-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	Cyclohexyl-
S	4-Cl-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	Ph-
S	4-Cl-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	2-Pyridyl-
S	4-Cl-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	3-Pyridyl-
S	4-Cl-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	4-Pyridyl-
S	4-Cl-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	2-Furyl-
S	4-Cl-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	3-Furyl-
S	4-Cl-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	2-Thienyl-
S	4-Cl-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	3-Thienyl-
S	4-Cl-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	-CH ₂ CN
S	4-Cl-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	-CH ₂ CO ₂ Et
S	4-Cl-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	-CH ₂ CO ₂ H
S	4-Cl-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	-(CH ₂) ₂ OH
S	4-Cl-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	-(CH ₂) ₂ OMe
S	4-Cl-Ph-	-H	-H	-CN	Ph-	-(CH ₂) ₃ NMe ₂

【0035】

【表121】

表 121

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
O	4-Me-Ph-	-H	-H	-CN	-(CH ₂) ₂ OMe	Me-
O	4-Me-Ph-	-H	-H	-CN	-(CH ₂) ₂ OMe	Et-
O	4-Me-Ph-	-H	-H	-CN	-(CH ₂) ₂ OMe	ⁿ Pr-
O	4-Me-Ph-	-H	-H	-CN	-(CH ₂) ₂ OMe	ⁿ Pr-
O	4-Me-Ph-	-H	-H	-CN	-(CH ₂) ₂ OMe	ⁿ Bu-
O	4-Me-Ph-	-H	-H	-CN	-(CH ₂) ₂ OMe	ⁿ Bu-
O	4-Me-Ph-	-H	-H	-CN	-(CH ₂) ₂ OMe	Cyclopentyl-
O	4-Me-Ph-	-H	-H	-CN	-(CH ₂) ₂ OMe	Cyclohexyl-
O	4-Me-Ph-	-H	-H	-CN	-(CH ₂) ₂ OMe	Ph-
O	4-Me-Ph-	-H	-H	-CN	-(CH ₂) ₂ OMe	2-Pyridyl-
O	4-Me-Ph-	-H	-H	-CN	-(CH ₂) ₂ OMe	3-Pyridyl-
O	4-Me-Ph-	-H	-H	-CN	-(CH ₂) ₂ OMe	4-Pyridyl-
O	4-Me-Ph-	-H	-H	-CN	-(CH ₂) ₂ OMe	2-Furyl-
O	4-Me-Ph-	-H	-H	-CN	-(CH ₂) ₂ OMe	3-Furyl-
O	4-Me-Ph-	-H	-H	-CN	-(CH ₂) ₂ OMe	2-Thienyl-
O	4-Me-Ph-	-H	-H	-CN	-(CH ₂) ₂ OMe	3-Thienyl-
O	4-Me-Ph-	-H	-H	-CN	-(CH ₂) ₂ OMe	-CH ₂ CN
O	4-Me-Ph-	-H	-H	-CN	-(CH ₂) ₂ OMe	-CH ₂ CO ₂ Et
O	4-Me-Ph-	-H	-H	-CN	-(CH ₂) ₂ OMe	-CH ₂ CO ₂ H
O	4-Me-Ph-	-H	-H	-CN	-(CH ₂) ₂ OMe	-(CH ₂) ₂ OH
O	4-Me-Ph-	-H	-H	-CN	-(CH ₂) ₂ OMe	-(CH ₂) ₂ OMe
O	4-Me-Ph-	-H	-H	-CN	-(CH ₂) ₂ OMe	-(CH ₂) ₃ NMe ₂

【表122】

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
0	4-Cl-Ph-	H	H	-CN	-(CH ₂) ₂ OMe	Me
0	4-Cl-Ph-	H	H	-CN	-(CH ₂) ₂ OMe	Et
0	4-Cl-Ph-	H	H	-CN	-(CH ₂) ₂ OMe	Pr
0	4-Cl-Ph-	H	H	-CN	-(CH ₂) ₂ OMe	Pr
0	4-Cl-Ph-	H	H	-CN	-(CH ₂) ₂ OMe	ⁿ Bu
0	4-Cl-Ph-	H	H	-CN	-(CH ₂) ₂ OMe	ⁿ Bu
0	4-Cl-Ph-	H	H	-CN	-(CH ₂) ₂ OMe	Cyclopentyl-
0	4-Cl-Ph-	H	H	-CN	-(CH ₂) ₂ OMe	Cyclohexyl-
0	4-Cl-Ph-	H	H	-CN	-(CH ₂) ₂ OMe	Ph-
0	4-Cl-Ph-	H	H	-CN	-(CH ₂) ₂ OMe	2-Pyridyl-
0	4-Cl-Ph-	H	H	-CN	-(CH ₂) ₂ OMe	3-Pyridyl-
0	4-Cl-Ph-	H	H	-CN	-(CH ₂) ₂ OMe	4-Pyridyl-
0	4-Cl-Ph-	H	H	-CN	-(CH ₂) ₂ OMe	2-Furyl-
0	4-Cl-Ph-	H	H	-CN	-(CH ₂) ₂ OMe	3-Furyl-
0	4-Cl-Ph-	H	H	-CN	-(CH ₂) ₂ OMe	2-Thienyl-
0	4-Cl-Ph-	H	H	-CN	-(CH ₂) ₂ OMe	3-Thienyl-
0	4-Cl-Ph-	H	H	-CN	-(CH ₂) ₂ OMe	-CH ₂ ON
0	4-Cl-Ph-	H	H	-CN	-(CH ₂) ₂ OMe	-CH ₂ CO ₂ Et
0	4-Cl-Ph-	H	H	-CN	-(CH ₂) ₂ OMe	-CH ₂ CO ₂ H
0	4-Cl-Ph-	H	H	-CN	-(CH ₂) ₂ OMe	-(CH ₂) ₂ OH
0	4-Cl-Ph-	H	H	-CN	-(CH ₂) ₂ OMe	-(CH ₂) ₂ OMe
0	4-Cl-Ph-	H	H	-CN	-(CH ₂) ₂ OMe	-(CH ₂) ₂ NMe ₂

【表 123】

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
0	4-Me-Ph-	H	H	-CN	4-F-Ph-	Me
0	4-Me-Ph-	H	H	-CN	4-F-Ph-	Et
0	4-Me-Ph-	H	H	-CN	4-F-Ph-	Pr
0	4-Me-Ph-	H	H	-CN	4-F-Ph-	Pr
0	4-Me-Ph-	H	H	-CN	4-F-Ph-	ⁿ Bu
0	4-Me-Ph-	H	H	-CN	4-F-Ph-	ⁿ Bu
0	4-Me-Ph-	H	H	-CN	4-F-Ph-	CF ₃ -
0	4-Me-Ph-	H	H	-CN	4-F-Ph-	Cyclopentyl-
0	4-Me-Ph-	H	H	-CN	4-F-Ph-	Cyclohexyl-
0	4-Me-Ph-	H	H	-CN	4-F-Ph-	Ph
0	4-Me-Ph-	H	H	-CN	4-F-Ph-	2-Pyridyl-
0	4-Me-Ph-	H	H	-CN	4-F-Ph-	3-Pyridyl-
0	4-Me-Ph-	H	H	-CN	4-F-Ph-	4-Pyridyl-
0	4-Me-Ph-	H	H	-CN	4-F-Ph-	2-Furyl-
0	4-Me-Ph-	H	H	-CN	4-F-Ph-	3-Furyl-
0	4-Me-Ph-	H	H	-CN	4-F-Ph-	2-Thienyl-
0	4-Me-Ph-	H	H	-CN	4-F-Ph-	3-Thienyl-
0	4-Me-Ph-	H	H	-CN	4-F-Ph-	-CH ₂ ON
0	4-Me-Ph-	H	H	-CN	4-F-Ph-	-CH ₂ CO ₂ Et
0	4-Me-Ph-	H	H	-CN	4-F-Ph-	-CH ₂ CO ₂ H
0	4-Me-Ph-	H	H	-CN	4-F-Ph-	-(CH ₂) ₂ OH
0	4-Me-Ph-	H	H	-CN	4-F-Ph-	-(CH ₂) ₂ OMe
0	4-Me-Ph-	H	H	-CN	4-F-Ph-	-(CH ₂) ₂ NMe ₂

【表 124】

表 124

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
0	4-Me-Ph-	H	H	-CN	-(CH ₂) ₂ NMe ₂	Me-
0	4-Me-Ph-	H	H	-CN	-(CH ₂) ₂ NMe ₂	Et-
0	4-Me-Ph-	H	H	-CN	-(CH ₂) ₂ NMe ₂	ⁿ Pr-
0	4-Me-Ph-	H	H	-CN	-(CH ₂) ₂ NMe ₂	ⁱ Pr-
0	4-Me-Ph-	H	H	-CN	-(CH ₂) ₂ NMe ₂	ⁿ Bu-
0	4-Me-Ph-	H	H	-CN	-(CH ₂) ₂ NMe ₂	ⁱ Bu-
0	4-Me-Ph-	H	H	-CN	-(CH ₂) ₂ NMe ₂	Cyclopentyl-
0	4-Me-Ph-	H	H	-CN	-(CH ₂) ₂ NMe ₂	Cyclohexyl-
0	4-Me-Ph-	H	H	-CN	-(CH ₂) ₂ NMe ₂	Ph-
0	4-Me-Ph-	H	H	-CN	-(CH ₂) ₂ NMe ₂	2-Pyridyl-
0	4-Me-Ph-	H	H	-CN	-(CH ₂) ₂ NMe ₂	3-Pyridyl-
0	4-Me-Ph-	H	H	-CN	-(CH ₂) ₂ NMe ₂	4-Pyridyl-
0	4-Me-Ph-	H	H	-CN	-(CH ₂) ₂ NMe ₂	2-Furyl-
0	4-Me-Ph-	H	H	-CN	-(CH ₂) ₂ NMe ₂	3-Furyl-
0	4-Me-Ph-	H	H	-CN	-(CH ₂) ₂ NMe ₂	2-Thienyl-
0	4-Me-Ph-	H	H	-CN	-(CH ₂) ₂ NMe ₂	3-Thienyl-
0	4-Me-Ph-	H	H	-CN	-(CH ₂) ₂ NMe ₂	-CH ₂ CN
0	4-Me-Ph-	H	H	-CN	-(CH ₂) ₂ NMe ₂	-CH ₂ CO ₂ Et
0	4-Me-Ph-	H	H	-CN	-(CH ₂) ₂ NMe ₂	-CH ₂ CO ₂ H
0	4-Me-Ph-	H	H	-CN	-(CH ₂) ₂ NMe ₂	-(CH ₂) ₂ OH
0	4-Me-Ph-	H	H	-CN	-(CH ₂) ₂ NMe ₂	-(CH ₂) ₂ OMe
0	4-Me-Ph-	H	H	-CN	-(CH ₂) ₂ NMe ₂	-(CH ₂) ₂ NMe ₂

【表 125】

表 125

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
0	4-Cl-Ph-	H	H	-CN	-(CH ₂) ₂ NMe ₂	Me-
0	4-Cl-Ph-	H	H	-CN	-(CH ₂) ₂ NMe ₂	Et-
0	4-Cl-Ph-	H	H	-CN	-(CH ₂) ₂ NMe ₂	ⁿ Pr-
0	4-Cl-Ph-	H	H	-CN	-(CH ₂) ₂ NMe ₂	ⁱ Pr-
0	4-Cl-Ph-	H	H	-CN	-(CH ₂) ₂ NMe ₂	ⁿ Bu-
0	4-Cl-Ph-	H	H	-CN	-(CH ₂) ₂ NMe ₂	ⁱ Bu-
0	4-Cl-Ph-	H	H	-CN	-(CH ₂) ₂ NMe ₂	Cyclopentyl-
0	4-Cl-Ph-	H	H	-CN	-(CH ₂) ₂ NMe ₂	Cyclohexyl-
0	4-Cl-Ph-	H	H	-CN	-(CH ₂) ₂ NMe ₂	Ph-
0	4-Cl-Ph-	H	H	-CN	-(CH ₂) ₂ NMe ₂	2-Pyridyl-
0	4-Cl-Ph-	H	H	-CN	-(CH ₂) ₂ NMe ₂	3-Pyridyl-
0	4-Cl-Ph-	H	H	-CN	-(CH ₂) ₂ NMe ₂	4-Pyridyl-
0	4-Cl-Ph-	H	H	-CN	-(CH ₂) ₂ NMe ₂	2-Furyl-
0	4-Cl-Ph-	H	H	-CN	-(CH ₂) ₂ NMe ₂	3-Furyl-
0	4-Cl-Ph-	H	H	-CN	-(CH ₂) ₂ NMe ₂	2-Thienyl-
0	4-Cl-Ph-	H	H	-CN	-(CH ₂) ₂ NMe ₂	3-Thienyl-
0	4-Cl-Ph-	H	H	-CN	-(CH ₂) ₂ NMe ₂	-CH ₂ CN
0	4-Cl-Ph-	H	H	-CN	-(CH ₂) ₂ NMe ₂	-CH ₂ CO ₂ Et
0	4-Cl-Ph-	H	H	-CN	-(CH ₂) ₂ NMe ₂	-CH ₂ CO ₂ H
0	4-Cl-Ph-	H	H	-CN	-(CH ₂) ₂ NMe ₂	-(CH ₂) ₂ OH
0	4-Cl-Ph-	H	H	-CN	-(CH ₂) ₂ NMe ₂	-(CH ₂) ₂ OMe
0	4-Cl-Ph-	H	H	-CN	-(CH ₂) ₂ NMe ₂	-(CH ₂) ₂ NMe ₂

【表 126】

表 126

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
0	2-Me-Ph	H	H	-CN	4-F-Ph	Me
0	2-Me-Ph	H	H	-CN	4-F-Ph	Et
0	2-Me-Ph	H	H	-CN	4-F-Ph	Pr
0	2-Me-Ph	H	H	-CN	4-F-Ph	Pr
0	2-Me-Ph	H	H	-CN	4-F-Ph	nBu
0	2-Me-Ph	H	H	-CN	4-F-Ph	Isu
0	2-Me-Ph	H	H	-CN	4-F-Ph	CF ₃
0	2-Me-Ph	H	H	-CN	4-F-Ph	Cyclopentyl
0	2-Me-Ph	H	H	-CN	4-F-Ph	Cyclohexyl
0	2-Me-Ph	H	H	-CN	4-F-Ph	Ph
0	2-Me-Ph	H	H	-CN	4-F-Ph	2-Pyridyl
0	2-Me-Ph	H	H	-CN	4-F-Ph	3-Pyridyl
0	2-Me-Ph	H	H	-CN	4-F-Ph	4-Pyridyl
0	2-Me-Ph	H	H	-CN	4-F-Ph	2-Furyl
0	2-Me-Ph	H	H	-CN	4-F-Ph	3-Furyl
0	2-Me-Ph	H	H	-CN	4-F-Ph	2-Thienyl
0	2-Me-Ph	H	H	-CN	4-F-Ph	3-Thienyl
0	2-Me-Ph	H	H	-CN	4-F-Ph	-CH ₂ CN
0	2-Me-Ph	H	H	-CN	4-F-Ph	-CH ₂ CO ₂ Et
0	2-Me-Ph	H	H	-CN	4-F-Ph	-CH ₂ CO ₂ H
0	2-Me-Ph	H	H	-CN	4-F-Ph	-(CH ₂) ₂ OH
0	2-Me-Ph	H	H	-CN	4-F-Ph	-(CH ₂) ₂ OMe
0	2-Me-Ph	H	H	-CN	4-F-Ph	-(CH ₂) ₂ NMe ₂

【表 127】

表 127

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
0	2-Cl-Ph	H	H	-CN	4-F-Ph	Me
0	2-Cl-Ph	H	H	-CN	4-F-Ph	Et
0	2-Cl-Ph	H	H	-CN	4-F-Ph	Pr
0	2-Cl-Ph	H	H	-CN	4-F-Ph	Pr
0	2-Cl-Ph	H	H	-CN	4-F-Ph	nBu
0	2-Cl-Ph	H	H	-CN	4-F-Ph	Isu
0	2-Cl-Ph	H	H	-CN	4-F-Ph	CF ₃
0	2-Cl-Ph	H	H	-CN	4-F-Ph	Cyclopentyl
0	2-Cl-Ph	H	H	-CN	4-F-Ph	Cyclohexyl
0	2-Cl-Ph	H	H	-CN	4-F-Ph	Ph
0	2-Cl-Ph	H	H	-CN	4-F-Ph	2-Pyridyl
0	2-Cl-Ph	H	H	-CN	4-F-Ph	3-Pyridyl
0	2-Cl-Ph	H	H	-CN	4-F-Ph	4-Pyridyl
0	2-Cl-Ph	H	H	-CN	4-F-Ph	2-Furyl
0	2-Cl-Ph	H	H	-CN	4-F-Ph	3-Furyl
0	2-Cl-Ph	H	H	-CN	4-F-Ph	2-Thienyl
0	2-Cl-Ph	H	H	-CN	4-F-Ph	3-Thienyl
0	2-Cl-Ph	H	H	-CN	4-F-Ph	-CH ₂ CN
0	2-Cl-Ph	H	H	-CN	4-F-Ph	-CH ₂ CO ₂ Et
0	2-Cl-Ph	H	H	-CN	4-F-Ph	-CH ₂ CO ₂ H
0	2-Cl-Ph	H	H	-CN	4-F-Ph	-(CH ₂) ₂ OH
0	2-Cl-Ph	H	H	-CN	4-F-Ph	-(CH ₂) ₂ OMe
0	2-Cl-Ph	H	H	-CN	4-F-Ph	-(CH ₂) ₂ NMe ₂

【表 128】

表 128

A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
0	4-Cl-Ph-	H	H	-CN	4-F-Ph-	Me-
0	4-Cl-Ph-	H	H	-CN	4-F-Ph-	Et-
0	4-Cl-Ph-	H	H	-CN	4-F-Ph-	Pr-
0	4-Cl-Ph-	H	H	-CN	4-F-Ph-	Isop-
0	4-Cl-Ph-	H	H	-CN	4-F-Ph-	Bu-
0	4-Cl-Ph-	H	H	-CN	4-F-Ph-	Oct-
0	4-Cl-Ph-	H	H	-CN	4-F-Ph-	CF ₃ -
0	4-Cl-Ph-	H	H	-CN	4-F-Ph-	Cyclopentyl-
0	4-Cl-Ph-	H	H	-CN	4-F-Ph-	Cyclohexyl-
0	4-Cl-Ph-	H	H	-CN	4-F-Ph-	Ph-
0	4-Cl-Ph-	H	H	-CN	4-F-Ph-	2-Pyridyl-
0	4-Cl-Ph-	H	H	-CN	4-F-Ph-	3-Pyridyl-
0	4-Cl-Ph-	H	H	-CN	4-F-Ph-	4-Pyridyl-
0	4-Cl-Ph-	H	H	-CN	4-F-Ph-	2-Furyl-
0	4-Cl-Ph-	H	H	-CN	4-F-Ph-	3-Furyl-
0	4-Cl-Ph-	H	H	-CN	4-F-Ph-	2-Thienyl-
0	4-Cl-Ph-	H	H	-CN	4-F-Ph-	3-Thienyl-
0	4-Cl-Ph-	H	H	-CN	4-F-Ph-	-CH ₂ CN
0	4-Cl-Ph-	H	H	-CN	4-F-Ph-	-CH ₂ CO ₂ Et
0	4-Cl-Ph-	H	H	-CN	4-F-Ph-	-CH ₂ CO ₂ H
0	4-Cl-Ph-	H	H	-CN	4-F-Ph-	-(CH ₂) ₂ OH
0	4-Cl-Ph-	H	H	-CN	4-F-Ph-	-(CH ₂) ₂ OMe
0	4-Cl-Ph-	H	H	-CN	4-F-Ph-	-(CH ₂) ₂ NMe ₂

【0036】一般式(1)または(2)で表される化合物は、必要に応じて医薬として許容される無機酸または有機酸との酸付加塩としては、例えば塩酸塩、臭化水素酸塩、硫酸塩、リン酸塩等の無機酸塩、および酢酸塩、乳酸塩、マレイン酸塩、シュウ酸塩、クエン酸塩、リンゴ酸塩、酒石酸塩、アスバラギン酸塩、グルタミン酸塩等の有機カルボン酸塩、メタスルホン酸塩、ペンゼンスルホン酸塩、P-トールエンスルホン酸塩、ヒドロキシベンゼンスルホン酸塩、ジヒドロキシベンゼンスルホン酸塩等のスルホン酸塩の塩が、また、薬理学的に許容されるアルカリ付加塩としては、アンモニウム塩、リチウム塩、ナトリウム塩、カリウム塩、カルシウム塩、マグネシウム塩等があげられる。本発明化合物は静脈内投与のみならず経口投与でも有効性を示すものである。前記一般式(1)または(2)で表される化合物またはその酸付加塩、アルカリ付加塩は、これを治療または予防する薬剤として用いるに当たり、非経口的または経口的に投与することが出来る。すなわち通常用いられる剤形態、例えば粉末、顆粒、錠剤、カプセル剤、シロップ剤、懸濁液等の剤形で経口的に投

5-アミノ-4-シアノ-1-フェニル- (1H) -ピラゾール [J. Org. Chem., 1240, 21, (1956)] より公知] (47) mg, 2.257mmol) のジクロロメタン (15 ml) の溶液に0℃にて攪拌下、4-トールエンホルミルシアナート (523 mg, 2.652 mmol) を滴下した。この溶液を徐々に室温まで昇温しながら7.7時間攪拌した。析出した結晶を濾取し、ジクロロメタンで洗浄し、減圧下乾燥し、4-シアノ-1-フェニル-5- (1H) -ピラゾール (820 mg, 84.1%) を合成した。融点 162-164℃

製造例2
1-フェニル-5- (3- (4-トールエンホルミル)-ウレイド) - (1H) -ピラゾール [Pol. J. Pharm. (1974), 26 (4), 479-482より公知] の合成
製造例1の方法に準じて5-アミノ-1-フェニル- (1H) -ピラゾールと4-トールエンホルミルシアナートより、反応を行い、1-フェニル-5- (3- (4-トールエンホルミル)-ウレイド) - (1H) -ピラゾールを合成した。融点 160-163℃

製造例3
3-メチル-1-フェニル-5- (3- (4-トールエンホルミル)-ウレイド) - (1H) -ピラゾール [P. J. Pharmacol. Pharm. (1974), 26 (4), 479-482より公知] の合成
製造例1の方法に準じて5-アミノ-3-メチル-1-フェニル- (1H) -ピラゾール [J. Org. Chem., 6155, 58, (1993)] より公知] と4-トールエンホルミルシアナートより、反応を行い、3-メチル-1-フェニル-5- (3- (4-トールエンホルミル)-ウレイド) - (1H) -ピラゾールを合成した。融点 147℃

製造例4
4-シアノ-1-フェニル-5- (3- (4-トールエンホルミル)-ウレイド) - (1H) -ピラゾールのナトリウム塩の合成
後記製造例4の方法に準じて4-シアノ-1-フェニル-5- (3- (4-トールエンホルミル)-ウレイド) - (1H) -ピラゾールより4-シアノ-1-フェニル-5- (3- (4-トールエンホルミル)-ウレイド) - (1H) -ピラゾールのナトリウム塩を得た。
IR (KBr) 3420, 2235, 1638, 1531, 1498, 1282, 1138cm⁻¹

【0038】製造例5
3- (3- (4-トールエンホルミル)-ウレイド) - (1H) -ピラゾール [名城大学農学報 28, 49-59, (1992) より公知] の合成
3-アミノ-1-フェニル-5- (3- (4-トールエンホルミル)-ウレイド) - (1H) -ピラゾール (3.830g, 46.095mmol) のジクロロメタン (20ml) およびテトラヒドロフラン (20ml) の混合溶液に0℃にて4-トールエンホルミル-5- (3- (4-トールエンホルミル)-ウレイド) - (1H) -ピラゾール (787mg, 53.0%) を合成した。
IR (KBr) 3271, 1720, 1599, 1510, 1352, 1280, 1155, 1090cm⁻¹

製造例1
4-シアノ-1-フェニル-5- (3- (4-トールエンホルミル)-ウレイド) - (1H) -ピラゾールの合成
製造例1の方法に準じて5-アミノ-4-シアノ-1-フェニル- (1H) -ピラゾール [J. Org. Chem., 1240, 21, (1956)] より公知] とベンゼンホルミルシアナートより、反応を行い、4-シアノ-1-フェニル-5- (3- (4-トールエンホルミル)-ウレイド) - (1H) -ピラゾール (787mg, 53.0%) を合成した。
IR (KBr) 3271, 1720, 1599, 1510, 1352, 1280, 1155, 1090cm⁻¹

ニルイソシアナート (7.10ml, 46.443mmol) を滴下し、0℃にて40分攪拌した。水-水浴を取り除き、徐々に室温まで昇温しながら、2時間攪拌した。溶液を減圧留去し、得られた残渣をジクロロメタンより再結晶を行ない、更に得られた結晶をトルエン-テトラヒドロフランの混合溶液より再結晶を行い、3- (3- (4-トールエンホルミル)-ウレイド) - (1H) -ピラゾールを合成した。
IR (KBr) 3332, 1699, 1507, 1145, 1088cm⁻¹

製造例6
4-エトキシカルボニル-3- (3- (4-トールエンホルミル)-ウレイド) - (1H) -ピラゾール [名城大学農学報 28, 49-59, (1992) より公知] の合成
3-アミノ-4-エトキシカルボニル- (1H) -ピラゾール (5.283g, 34.049mmol) のジクロロメタン (20ml) およびテトラヒドロフラン (20ml) の混合溶液に0℃にて4-トールエンホルミルイソシアナート (5.50ml, 35.977mmol) を滴下し、0℃にて30分攪拌した。水-水浴を取り除き、徐々に室温まで昇温しながら、2-3時間攪拌した。析出した結晶を濾取し、ジクロロメタンにて洗浄後、得られた結晶をジクロロメタンより再結晶を行い、4-エトキシカルボニル-3- (3- (4-トールエンホルミル)-ウレイド) - (1H) -ピラゾールを合成した。
IR (KBr) 3310, 1737, 1668, 1596, 1500, 1352, 1279, 1148, 1121, 1089, 944cm⁻¹

【0039】製造例7
4-カルボキシル-3- (3- (4-トールエンホルミル)-ウレイド) - (1H) -ピラゾールの合成
4-エトキシカルボニル-3- (3- (4-トールエンホルミル)-ウレイド) - (1H) -ピラゾール (1.615 g, 4.583 mmol) のエタノール (60ml) に室温下に、10N 水酸化カリウム水溶液を40ml加えた。60分間室温にて攪拌した後に、60℃にて1時間攪拌した。室温にて冷却した後、塩酸を加え、中和し、析出した結晶を濾取し、水にて洗浄後、減圧下乾燥し、4-カルボキシル-3- (3- (4-トールエンホルミル)-ウレイド) - (1H) -ピラゾール (787mg, 53.0%) を合成した。
IR (KBr) 3271, 1720, 1599, 1510, 1352, 1280, 1155, 1090cm⁻¹

(1H) -ピラゾールを合成した。融点 159-161℃

実施例2

4-シアノ-1-(2-ピリジル)-5-[3-(4-トルエンホルボニル)-ウレイド]-(1H)-ピラゾールの合成

製造例1の方法に準じて5-アミノ-4-シアノ-1-(2-ピリジル)-(1H)-ピラゾール [特開昭62-195376より公知] と4-トルエンホルボニルイソシアナートより、反応を行い、4-シアノ-1-(2-ピリジル)-5-[3-(4-トルエンホルボニル)-ウレイド]-(1H)-ピラゾールを合成した。融点 253-256℃

実施例3

4-シアノ-1-メチル-5-[3-(4-トルエンホルボニル)-ウレイド]-(1H)-ピラゾールの合成
製造例1の方法に準じて5-アミノ-4-シアノ-1-メチル-(1H)-ピラゾール [J. Org. Chem., 1240, 21, (1956) より公知] と4-トルエンホルボニルイソシアナートより、反応を行い、4-シアノ-1-メチル-5-[3-(4-トルエンホルボニル)-ウレイド]-(1H)-ピラゾールを合成した。融点 300℃以上

実施例4

4-シアノ-1-シクロヘキシル-5-[3-(4-トルエンホルボニル)-ウレイド]-(1H)-ピラゾールの合成

製造例1の方法に準じて5-アミノ-4-シアノ-1-シクロヘキシル-(1H)-ピラゾール [Chem. Abstr. 1459, 56, (1962) より公知] と4-トルエンホルボニルイソシアナートより、反応を行い、4-シアノ-1-シクロヘキシル-5-[3-(4-トルエンホルボニル)-ウレイド]-(1H)-ピラゾールを合成した。融点 273-277℃

実施例5

4-シアノ-1-(7-クロロキノリン-4-イル)-5-[3-(4-トルエンホルボニル)-ウレイド]-(1H)-ピラゾールの合成

製造例1の方法に準じて5-アミノ-4-シアノ-1-(7-クロロキノリン-4-イル)-(1H)-ピラゾール [米国特許第4622300号より公知] と4-トルエンホルボニルイソシアナートより、反応を行い、4-シアノ-1-(7-クロロキノリン-4-イル)-5-[3-(4-トルエンホルボニル)-ウレイド]-(1H)-ピラゾールを合成した。融点 300℃以上

[0040] 実施例6

4-シアノ-1-(4-ニトロフェニル)-5-[3-(4-トルエンホルボニル)-ウレイド]-(1H)-ピラゾールの合成

製造例1の方法に準じて5-アミノ-4-シアノ-1-

(4-ニトロフェニル)-(1H)-ピラゾール [J. Org. Chem., 1240, 21, (1956) より公知] と4-トルエンホルボニルイソシアナートより、反応を行い、4-シアノ-1-(4-ニトロフェニル)-5-[3-(4-トルエンホルボニル)-ウレイド]-(1H)-ピラゾールを合成した。融点 300℃以上

実施例7

4-シアノ-1-(4-アミノフェニル)-5-[3-(4-トルエンホルボニル)-ウレイド]-(1H)-ピラゾールの合成
4-シアノ-1-(4-ニトロフェニル)-5-[3-(4-トルエンホルボニル)-ウレイド]-(1H)-ピラゾール (480mg, 1.126mmol) 及び 20% 三塩化タン水溶液 (8.70ml, 11.281mmol) のアセトン溶液 (150ml) を室温で4時間攪拌した。この反応溶液を水-氷に注ぎ、この溶液を飽和重炭酸水溶液を加え、pH 9とした。これを酢酸エチルで抽出し、得られた有機層を飽和食塩水で洗浄した後、無水硫酸ナトリウムで乾燥後、減圧留去し残渣を得た。これをシリカゲルカラムクロマトグラフィー (酢酸エチル/メタノール 20:1) にて精製し、4-シアノ-1-(4-アミノフェニル)-5-[3-(4-トルエンホルボニル)-ウレイド]-(1H)-ピラゾール (88mg, 19.7%) を合成した。融点 275℃で分解 (ジクロロメタンより再結晶を行った。)

実施例8

4-シアノ-1-(4-アセチルアミノフェニル)-5-[3-(4-トルエンホルボニル)-ウレイド]-(1H)-ピラゾールの合成
4-シアノ-1-(4-アミノフェニル)-5-[3-(4-トルエンホルボニル)-ウレイド]-(1H)-ピラゾール (8.8mg, 0.0222mmol), 塩化セチル (3μl, 0.0422mmol) 及びトリエチルアミン (20μl, 0.143mmol) のジクロロメタン (2ml) 及びテトラヒドロフラン (2ml) の混合溶液を0℃から室温まで昇温しながら、1時間攪拌した。これを水-氷に注ぎ、酢酸エチルにて抽出した。得られた有機層を飽和食塩水にて洗浄後、無水硫酸ナトリウムにて乾燥後、減圧留去し、残渣を得た。これを分取層クロマトグラフィー (酢酸エチル/メタノール 10:1) にて精製し、4-シアノ-1-(4-アセチルアミノフェニル)-5-[3-(4-トルエンホルボニル)-ウレイド]-(1H)-ピラゾール (2.8mg, 28.6%) を合成した。

IR (KBr) 3228, 2239, 1675, 1572, 1519, 1414, 1371, 1309, 1265cm⁻¹

実施例9

4-シアノ-1-(4-メチルフェニル)-5-[3-(4-トルエンホルボニル)-ウレイド]-(1H)-ピラゾールの合成

製造例1の方法に準じて5-アミノ-4-シアノ-1-(4-メチルフェニル)-(1H)-ピラゾール [J. Org. Chem., 1240, 21, (1956) より公知] と4-トルエンホルボニルイソシアナートより、反応を行い、4-シアノ-1-(4-メチルフェニル)-5-[3-(4-トルエンホルボニル)-ウレイド]-(1H)-ピラゾールを合成した。融点 172-174℃

[0041] 実施例10

4-シアノ-1-(4-クロロフェニル)-5-[3-(4-トルエンホルボニル)-ウレイド]-(1H)-ピラゾールの合成

製造例1の方法に準じて5-アミノ-4-シアノ-1-(4-クロロフェニル)-(1H)-ピラゾール [J. Org. Chem., 1240, 21, (1956) より公知] と4-トルエンホルボニルイソシアナートより、反応を行い、4-シアノ-1-(4-クロロフェニル)-5-[3-(4-トルエンホルボニル)-ウレイド]-(1H)-ピラゾールを合成した。融点 168-170℃

実施例11

4-シアノ-1-(4-プロモフェニル)-5-[3-(4-トルエンホルボニル)-ウレイド]-(1H)-ピラゾールの合成

製造例1の方法に準じて5-アミノ-4-シアノ-1-(4-プロモフェニル)-(1H)-ピラゾール [J. Org. Chem., 1240, 21, (1956) より公知] と4-トルエンホルボニルイソシアナートより、反応を行い、4-シアノ-1-(4-プロモフェニル)-5-[3-(4-トルエンホルボニル)-ウレイド]-(1H)-ピラゾールを合成した。融点 179-181℃

実施例12

4-シアノ-1-(1-ナフチル)-5-[3-(4-トルエンホルボニル)-ウレイド]-(1H)-ピラゾールの合成

4-シアノ-5-アミノ-1-(1-ナフチル)-(1H)-ピラゾールの合成

エトキシメチレンマロノニトリル (4.04g, 33.080mmol), 1-ナフチルヒドラジン塩酸塩 (6.44g, 33.083mmol), ナトリウムエチラート (2.26g, 33.211mmol) のエタノール (150ml) 溶液を4時間加熱還流した。冷却後、減圧留去し残渣を得た。これに水を加え、酢酸エチルにて抽出した。この有機層を飽和食塩水で洗浄後、硫酸ナトリウムにて乾燥し、減圧留去し残渣を得た。これをシリカゲルカラムクロマトグラフィー (クロロホルム-酢酸エチル 10:1) にて精製し、5-アミノ-4-シアノ-1-(1-ナフチル)-(1H)-ピラゾール (2.299g, 29.7%) を合成した。

IR (KBr) 3646, 3381, 3164, 2216, 1662, 1536 cm⁻¹
b) 4-シアノ-1-(1-ナフチル)-5-[3-(4-トルエンホルボニル)-ウレイド]-(1H)-

ピラゾールの合成

製造例1の方法に準じて5-アミノ-4-シアノ-1-(1-ナフチル)-(1H)-ピラゾールと4-トルエンホルボニルイソシアナートより、反応を行い、4-シアノ-1-(1-ナフチル)-5-[3-(4-トルエンホルボニル)-ウレイド]-(1H)-ピラゾールを合成した。融点 176-178℃

実施例13

4-シアノ-1-(2-ベンゾチアゾリル)-5-[3-(4-トルエンホルボニル)-ウレイド]-(1H)-ピラゾールの合成

a) 5-アミノ-4-シアノ-1-(2-ベンゾチアゾリル)-(1H)-ピラゾールの合成
エトキシメチレンマロノニトリル (1.944g, 15.917mmol), 2-ヒドラジノベンゾチアゾール (2.631g, 15.924mmol) のエタノール (150ml) 溶液を4.8時間加熱還流した。次に、加熱還流したままエタノールを約100ml留去した後冷却した。析出した結晶を濾取しエタノールで洗浄し減圧乾燥し、5-アミノ-4-シアノ-1-(2-ベンゾチアゾリル)-(1H)-ピラゾール (3.293g, 85.7%) を合成した。融点 248-250℃

b) 4-シアノ-1-(2-ベンゾチアゾリル)-5-[3-(4-トルエンホルボニル)-ウレイド]-(1H)-ピラゾールの合成

製造例1の方法に準じて5-アミノ-4-シアノ-1-(2-ベンゾチアゾリル)-(1H)-ピラゾールと4-トルエンホルボニルイソシアナートより、反応を行い、4-シアノ-1-(2-ベンゾチアゾリル)-5-[3-(4-トルエンホルボニル)-ウレイド]-(1H)-ピラゾールを合成した。融点 300℃以上

実施例14

4-シアノ-1-ベンジル-5-[3-(4-トルエンホルボニル)-ウレイド]-(1H)-ピラゾールの合成

製造例1の方法に準じて公知の5-アミノ-4-シアノ-1-ベンジル-(1H)-ピラゾール [特開昭60-115581より公知] と4-トルエンホルボニルイソシアナートより、反応を行い、4-シアノ-1-ベンジル-5-[3-(4-トルエンホルボニル)-ウレイド]-(1H)-ピラゾールを合成した。融点 153-156℃

実施例15

4-シアノ-1-(2-イミダゾリル)-5-[3-(4-トルエンホルボニル)-ウレイド]-(1H)-ピラゾールの合成

a) 5-アミノ-4-シアノ-1-(2-イミダゾリル)-(1H)-ピラゾールの合成
エトキシメチレンマロノニトリル (4.070g, 33.325mmol), 2-ヒドラジノ-2-イミダゾリル炭化水素酸

塩 (6.030g, 33.308mmol) 、ナトリウムエチラート (2.404g, 33.327mmol) のエタノール (150 ml) 溶液を2.5時間加熱還流した。冷却後、減圧留去し残渣を得た。これに水を加え、酢酸エチルにて抽出した。この有機層を飽和食塩水で洗浄後、硫酸ナトリウムにて乾燥し、濃縮し、減圧留去して残渣を得た。これをエタノールより再結晶を行った。更にこれをシリカゲルカラムクロマトグラフィー (クロロホルム-酢酸エチル 4:1) にて精製し、5-アミノ-4-シアノ-1- (2-イミダゾリニル) - (1H) -ピラゾール (2.050g, 3.51%) を合成した。

IR (KBr) 3363, 3208, 2233, 1647, 1556 cm^{-1}
 b) 4-シアノ-1- (2-イミダゾリニル) -5- (3- (4- (4-トルエンシルボニル) -ウレイド) - (1H) -ピラゾールの合成
 製造例1の方法に準じて5-アミノ-4-シアノ-1- (2-イミダゾリニル) - (1H) -ピラゾールと4-トルエンシルボニルイソシアナートより、反応を行い、4-シアノ-1- (2-イミダゾリニル) -5- (3- (4- (4-トルエンシルボニル) -ウレイド) - (1H) -ピラゾールを合成した。融点 280℃にて分解
 【0042】実施例16
 4-シアノ-1- (2-ニトロフェニル) -5- (3- (4-トルエンシルボニル) -ウレイド) - (1H) -ピラゾールの合成
 製造例1の方法に準じて5-アミノ-4-シアノ-1- (2-ニトロフェニル) - (1H) -ピラゾール [J. Heterocyclic Chem., 511, 20, (1983) より公知] と4-トルエンシルボニルイソシアナートより、反応を行い、4-シアノ-1- (2-ニトロフェニル) -5- (3- (4-トルエンシルボニル) -ウレイド) - (1H) -ピラゾールを合成した。融点 167-170℃

実施例17
 4-シアノ-1- (2-アミノフェニル) -5- (3- (4-トルエンシルボニル) -ウレイド) - (1H) -ピラゾールの合成
 1- (2-ニトロフェニル) -4-シアノ-5- (3- (4-トルエンシルボニル) -ウレイド) - (1H) -ピラゾール (10mmol) 、10%パラジウム炭素 (34mg) の酢酸エチル (100ml) 及びメタノール (10ml) の混合溶液を室温下、水素添加反応を2時間行った。この溶液をセライトを用い濃縮し、濃液を減圧留去し残渣を得た。これをシリカゲルカラムクロマトグラフィー (メタノール-クロロホルム-アセトニトリ 10:90:1) にて精製し、4-シアノ-1- (2-アミノフェニル) -5- (3- (4-トルエンシルボニル) -ウレイド) - (1H) -ピラゾール (13mg, 99.0%) を得た。融点 193-196℃

実施例18
 4-シアノ-1- (2-メチルフェニル) -5- (3- (4-トルエンシルボニル) -ウレイド) - (1H) -ピラゾールの合成
 製造例1の方法に準じて5-アミノ-4-シアノ-1- (2-メチルフェニル) - (1H) -ピラゾール [J. Heterocyclic Chem., 511, 20, (1983) より公知] と4-トルエンシルボニルイソシアナートより、反応を行い、4-シアノ-1- (2-メチルフェニル) -5- (3- (4-トルエンシルボニル) -ウレイド) - (1H) -ピラゾールを合成した。融点 161-164℃

実施例22
 1-フェニル-5- (3- (2-トルエンシルボニル) -ウレイド) - (1H) -ピラゾールの合成
 製造例1の方法に準じて5-アミノ-4-シアノ-1- (2-メチルフェニル) - (1H) -ピラゾール [特開平6-503069より公知] と4-トルエンシルボニルイソシアナートより、反応を行い、4-シアノ-1- (2-ニトロフェニル) -5- (3- (4-トルエンシルボニル) -ウレイド) - (1H) -ピラゾールを合成した。融点 156-159℃

実施例19
 4-シアノ-1- (2-クロロフェニル) -5- (3- (4-トルエンシルボニル) -ウレイド) - (1H) -ピラゾールの合成
 製造例1の方法に準じて5-アミノ-4-シアノ-1- (2-クロロフェニル) - (1H) -ピラゾール [J. Med. Chem., 3263, 35, (1982) より公知] と4-トルエンシルボニルイソシアナートより、反応を行い、4-シアノ-1- (2-クロロフェニル) -5- (3- (4-トルエンシルボニル) -ウレイド) - (1H) -ピラゾールを合成した。融点 174-177℃

実施例20
 4-シアノ-1- (2-ニトロフェニル) -5- (3- (4-トルエンシルボニル) -ウレイド) - (1H) -ピラゾールの合成
 製造例1の方法に準じて5-アミノ-4-シアノ-1- (2-ニトロフェニル) - (1H) -ピラゾール [J. Med. Chem., 2892, 34, (1991) より公知] と4-トルエンシルボニルイソシアナートより、反応を行い、4-シアノ-1- (2-ニトロフェニル) -5- (3- (4-トルエンシルボニル) -ウレイド) - (1H) -ピラゾールを合成した。融点 174-177℃

(4-トルエンシルボニル) -ウレイド) - (1H) -ピラゾールの合成
 製造例1の方法に準じて5-アミノ-4-シアノ-1- (2-メチルフェニル) - (1H) -ピラゾール [特開平6-503069より公知] と4-トルエンシルボニルイソシアナートより、反応を行い、4-シアノ-1- (2-ニトロフェニル) -5- (3- (4-トルエンシルボニル) -ウレイド) - (1H) -ピラゾールを合成した。融点 156-159℃

実施例19
 4-シアノ-1- (2-クロロフェニル) -5- (3- (4-トルエンシルボニル) -ウレイド) - (1H) -ピラゾールの合成
 製造例1の方法に準じて5-アミノ-4-シアノ-1- (2-クロロフェニル) - (1H) -ピラゾール [J. Med. Chem., 2892, 34, (1991) より公知] と4-トルエンシルボニルイソシアナートより、反応を行い、4-シアノ-1- (2-クロロフェニル) -5- (3- (4-トルエンシルボニル) -ウレイド) - (1H) -ピラゾールを合成した。融点 174-177℃

実施例20
 4-シアノ-1- (2-ニトロフェニル) -5- (3- (4-トルエンシルボニル) -ウレイド) - (1H) -ピラゾールの合成
 製造例1の方法に準じて5-アミノ-4-シアノ-1- (2-ニトロフェニル) - (1H) -ピラゾール [J. Med. Chem., 2892, 34, (1991) より公知] と4-トルエンシルボニルイソシアナートより、反応を行い、4-シアノ-1- (2-ニトロフェニル) -5- (3- (4-トルエンシルボニル) -ウレイド) - (1H) -ピラゾールを合成した。融点 174-177℃

実施例21
 4-シアノ-1- (2-ニトロフェニル) -5- (3- (4-トルエンシルボニル) -ウレイド) - (1H) -ピラゾールの合成
 製造例1の方法に準じて5-アミノ-4-シアノ-1- (2-ニトロフェニル) - (1H) -ピラゾール [J. Heterocyclic Chem., 511, 20, (1983) より公知] と4-トルエンシルボニルイソシアナートより、反応を行い、4-シアノ-1- (2-ニトロフェニル) -5- (3- (4-トルエンシルボニル) -ウレイド) - (1H) -ピラゾールを合成した。融点 161-164℃

【0043】実施例21
 4-シアノ-1- (2-ニトロフェニル) -5- (3- (4-トルエンシルボニル) -ウレイド) - (1H) -ピラゾールの合成
 製造例1の方法に準じて5-アミノ-4-シアノ-1- (2-ニトロフェニル) - (1H) -ピラゾール [J. Heterocyclic Chem., 511, 20, (1983) より公知] と4-トルエンシルボニルイソシアナートより、反応を行い、4-シアノ-1- (2-ニトロフェニル) -5- (3- (4-トルエンシルボニル) -ウレイド) - (1H) -ピラゾールを合成した。融点 161-164℃

5-アミノ-4-シアノ-1- (2-ニトロフェニル) - (1H) -ピラゾール [J. Heterocyclic Chem., 511, 20, (1983) より公知] と4-トルエンシルボニルイソシアナートより、反応を行い、4-シアノ-1- (2-ニトロフェニル) -5- (3- (4-トルエンシルボニル) -ウレイド) - (1H) -ピラゾールを合成した。融点 161-164℃

IR (KBr) 2935, 2233, 1720, 1615, 1278 cm^{-1}
 4-シアノ-1- (2-メチルフェニル) -5- (3- (4-トルエンシルボニル) -ウレイド) - (1H) -ピラゾールの合成
 製造例1の方法に準じて5-アミノ-4-シアノ-1- (2-メチルフェニル) - (1H) -ピラゾール [J. Heterocyclic Chem., 511, 20, (1983) より公知] と4-トルエンシルボニルイソシアナートより、反応を行い、4-シアノ-1- (2-メチルフェニル) -5- (3- (4-トルエンシルボニル) -ウレイド) - (1H) -ピラゾールを合成した。融点 161-164℃

5-アミノ-4-シアノ-1- (2-メチルフェニル) - (1H) -ピラゾール [J. Org. Chem., 1240, 21, (1956) より公知] (228mg, 1.149mmol) のジクロロメタン (10ml) に2-トルエンシルボニルイソシアナート (200 μ l, 1.370mmol) を0℃にて滴下した後に、0℃にて20分撹拌し、氷-水浴を取り除き、徐々に室温まで昇温しながら100分撹拌した。反応液にエーテルを加え、析出した結晶を遠心した。これをシリカゲルカラムクロマトグラフィー (メタノール-クロロホルム 1:9) にて精製し、4-シアノ-1- (2-メチルフェニル) -5- (3- (4-トルエンシルボニル) -ウレイド) - (1H) -ピラゾール (32mg, 7.0%) を合成した。

IR (KBr) 3418, 2231, 1617, 1310, 1272 cm^{-1}
 実施例27
 4-シアノ-1- (2-エチル-1-フェニル-5- (3- (4-トルエンシルボニル) -ウレイド) - (1H) -ピラゾールの合成
 製造例1の方法に準じて5-アミノ-4-シアノ-1- (2-エチル-1-フェニル) - (1H) -ピラゾール [Chem. Abstr., 79, 146518 より公知] と4-トルエンシルボニルイソシアナートより、反応を行い、4-シアノ-1- (2-エチル-1-フェニル) -5- (3- (4-トルエンシルボニル) -ウレイド) - (1H) -ピラゾールを合成した。融点 161-164℃

実施例28
 4-シアノ-1- (2-エチル-1-フェニル-5- (3- (4-トルエンシルボニル) -ウレイド) - (1H) -ピラゾールの合成
 製造例1の方法に準じて5-アミノ-4-シアノ-1- (2-エチル-1-フェニル) - (1H) -ピラゾール [Chem. Abstr., 79, 146518 より公知] と4-トルエンシルボニルイソシアナートより、反応を行い、4-シアノ-1- (2-エチル-1-フェニル) -5- (3- (4-トルエンシルボニル) -ウレイド) - (1H) -ピラゾールを合成した。融点 161-164℃

実施例29
 3- (4-トルエンシルボニル) -5- (3- (4-トルエンシルボニル) -ウレイド) - (1H) -ピラゾールの合成
 製造例1の方法に準じて5-アミノ-4-シアノ-1- (2-メチルフェニル) - (1H) -ピラゾール [J. Org. Chem., 1240, 21, (1956) より公知] と4-トルエンシルボニルイソシアナートより、反応を行い、4-シアノ-1- (2-メチルフェニル) -5- (3- (4-トルエンシルボニル) -ウレイド) - (1H) -ピラゾールを合成した。融点 159-161℃

実施例30
 3- (4-トルエンシルボニル) -5- (3- (4-トルエンシルボニル) -ウレイド) - (1H) -ピラゾールの合成
 製造例1の方法に準じて5-アミノ-4-シアノ-1- (2-メチルフェニル) - (1H) -ピラゾール [J. Org. Chem., 1240, 21, (1956) より公知] と4-トルエンシルボニルイソシアナートより、反応を行い、4-シアノ-1- (2-メチルフェニル) -5- (3- (4-トルエンシルボニル) -ウレイド) - (1H) -ピラゾールを合成した。融点 161-164℃

実施例31
 4-シアノ-1- (2-メチルフェニル) -5- (3- (4-トルエンシルボニル) -ウレイド) - (1H) -ピラゾールの合成
 製造例1の方法に準じて5-アミノ-4-シアノ-1- (2-メチルフェニル) - (1H) -ピラゾール [J. Org. Chem., 1240, 21, (1956) より公知] と4-トルエンシルボニルイソシアナートより、反応を行い、4-シアノ-1- (2-メチルフェニル) -5- (3- (4-トルエンシルボニル) -ウレイド) - (1H) -ピラゾールを合成した。融点 161-164℃

実施例32
 4-シアノ-1- (2-メチルフェニル) -5- (3- (4-トルエンシルボニル) -ウレイド) - (1H) -ピラゾールの合成
 製造例1の方法に準じて5-アミノ-4-シアノ-1- (2-メチルフェニル) - (1H) -ピラゾール [J. Org. Chem., 1240, 21, (1956) より公知] と4-トルエンシルボニルイソシアナートより、反応を行い、4-シアノ-1- (2-メチルフェニル) -5- (3- (4-トルエンシルボニル) -ウレイド) - (1H) -ピラゾールを合成した。融点 161-164℃

ルエンスルホニル) -ウレイド) - (IH) -ピラゾールの合成

製造例1の方法に準じて5-アミノ-4-シアノ-1,3-ジフェニル (IH) -ピラゾール [J. Heterocyclic Chem. 647, 27, (1990) より公知] と2-トリエンズルホニルイソシアナートより、反応を行い、4-シアノ-1,3-ジフェニル-5-[3-(2-トリエンズルホニル) -ウレイド) - (IH) -ピラゾール] を合成した。融点 219-221°C

実施例33

4-シアノ-3-シアノメチル-1-フェニル-5-[3-(4-トリエンズルホニル) -ウレイド) - (IH) -ピラゾール] の合成

製造例1の方法に準じて5-アミノ-4-シアノ-3-シアノメチル-1-フェニル (IH) -ピラゾール [J. Am. Chem. Soc., 2456, 81, (1959) より公知] と4-トリエンズルホニルイソシアナートより、反応を行い、4-シアノ-3-シアノメチル-1-フェニル-5-[3-(4-トリエンズルホニル) -ウレイド) - (IH) -ピラゾール] を合成した。融点 159-161°C

実施例34

4-シアノ-3-エトキシカルボニルメチル-1-フェニル-5-[3-(4-トリエンズルホニル) -ウレイド) - (IH) -ピラゾール] の合成

製造例1の方法に準じて5-アミノ-4-シアノ-3-エトキシカルボニルメチル-1-フェニル (IH) -ピラゾール [J. Am. Chem. Soc., 2456, 81, (1959) より公知] と4-トリエンズルホニルイソシアナートより、反応を行い、4-シアノ-3-エトキシカルボニルメチル-1-フェニル-5-[3-(4-トリエンズルホニル) -ウレイド) - (IH) -ピラゾール] を合成した。融点 108-110°C

実施例35

4-シアノ-3-カルボキシメチル-1-フェニル-5-[3-(4-トリエンズルホニル) -ウレイド) - (IH) -ピラゾール] の合成

4-シアノ-3-エトキシカルボニルメチル-1-フェニル-5-[3-(4-トリエンズルホニル) -ウレイド) - (IH) -ピラゾール (502mg, 1.073mmol) のエタノール (20ml) 溶液に0°Cにて4N水酸化カリウム水溶液 (5ml) を滴下した。この溶液を撹拌しながら、1.5時間かけて10°Cまで昇温した。この反応溶液を0°Cに冷却し、2N塩酸水溶液を滴下し、pH3にした。これを酢酸エチルにて抽出し、飽和食塩水で洗浄した後に硫酸ナトリウムで乾燥し、通過した後に減圧留去し、4-シアノ-3-カルボキシメチル-1-フェニル-5-[3-(4-トリエンズルホニル) -ウレイド) - (IH) -ピラゾール (364mg, 77.1%) を得た。

IR (KBr) 3216, 2232, 1702, 1598, 1534, 1478, 135

1, 1235, 1162cm⁻¹
【0046】実施例36

4-シアノ-1-フェニル-5-[3-(4-クロロベンゼンスルホニル) -ウレイド) - (IH) -ピラゾールの合成

製造例1の方法に準じて5-アミノ-4-シアノ-1-フェニル (IH) -ピラゾール [J. Org. Chem., 124, 21, (1956) より公知] と4-クロロベンゼンズルホニルイソシアナートより、反応を行い、4-シアノ-1-フェニル-5-[3-(4-クロロベンゼンズルホニル) -ウレイド) - (IH) -ピラゾール] を合成した。融点 159-161°C

実施例37

4-シアノ-3-メチル-1-フェニル-5-[3-(4-クロロベンゼンズルホニル) -ウレイド) - (IH) -ピラゾールの合成

製造例1の方法に準じて5-アミノ-4-シアノ-3-メチル-1-フェニル (IH) -ピラゾール [J. Org. Chem., 1240, 21, (1956) より公知] と4-クロロベンゼンズルホニルイソシアナートより、反応を行い、4-シアノ-3-メチル-1-フェニル-5-[3-(4-クロロベンゼンズルホニル) -ウレイド) - (IH) -ピラゾール] を合成した。融点 163-165°C

実施例38

4-シアノ-3-エチル-1-フェニル-5-[3-(4-クロロベンゼンズルホニル) -ウレイド) - (IH) -ピラゾールの合成

製造例1の方法に準じて5-アミノ-4-シアノ-3-エチル-1-フェニル (IH) -ピラゾール [Chem. Abstract, 79, 146518より公知] と4-クロロベンゼンズルホニルイソシアナートより、反応を行い、4-シアノ-3-エチル-1-フェニル-5-[3-(4-クロロベンゼンズルホニル) -ウレイド) - (IH) -ピラゾール] を合成した。融点 152-154°C

実施例39

4-シアノ-3-(2-ジメチルアミノエチル) -1-フェニル-5-[3-(4-クロロベンゼンズルホニル) -ウレイド) - (IH) -ピラゾールの合成

4-シアノ-5-[3-(tert-ブトキシカルボニル) -アミノ] -3-エトキシカルボニルメチル-1-フェニル (IH) -ピラゾールの合成
5-アミノ-4-シアノ-3-エトキシカルボニルメチル-1-フェニル (IH) -ピラゾール (6.025 g, 2.291mmol) とジ-tert-ブチルカルボネート (10.640g, 48.751mmol) 及びジメチルアミノピリジン (300mg, 2.456mmol) のジクロロメタン (50ml) 溶液を室温で4時間撹拌した。これに水を加え、有機層を分離した後に水層をクロロホルムにて抽出した。合わせた有機層を飽和食塩水にて洗浄後、無水硫酸ナトリウムにて乾燥後、通過し、減圧留去し残渣を得た。これをシリカ

乾燥後、通過し、減圧留去し残渣を得た。これをシリカ

ゲルカラムクロマトグラフィー (クロロホルム-酢酸エチル 4:1) にて精製し、4-シアノ-5-[3-(tert-ブトキシカルボニル) -アミノ] -3-エトキシカルボニルメチル-1-フェニル (IH) -ピラゾール (10.488 g, 1.00%) を得た。

IR (neat) 3000, 2950, 2245, 1815, 1780, 1740, 1575, 1505, 1455, 1400, 1375, 1255, 1150, 1120, 1100cm⁻¹

b) 4-シアノ-5-tert-ブトキシカルボニルアミノ-3-(2-ヒドロキシエチル) -1-フェニル (IH) -ピラゾールの合成。

窒素雰囲気下、水酸化リチウムアルミニウム (977mg, 2.574mmol) のテトラヒドロフラン (50ml) 懸濁液に4-シアノ-5-[3-(tert-ブトキシカルボニル) -アミノ] -3-エトキシカルボニルメチル-1-フェニル (IH) -ピラゾール (2.115g, 25.749mmol) のテトラヒドロフラン (100ml) 溶液を0°Cにて20分かけて滴下した。この溶液を0°Cにて70分撹拌した。この反応溶液にテトラヒドロフランと水の1:1の混合溶液を0°Cにて滴下した。得られた溶液をセライトを用い、通過し、濾液を減圧留去し残渣を得た。これに飽和食塩水を加え、酢酸エチルにて抽出した。有機層を飽和食塩水で洗浄後、無水硫酸ナトリウムにて乾燥し、通過した後に減圧留去し残渣を得た。これをシリカゲルカラムクロマトグラフィー (クロロホルム-酢酸エチル 4:1) にて精製し、4-シアノ-5-tert-ブトキシカルボニルアミノ-3-(2-ヒドロキシエチル) -1-フェニル (IH) -ピラゾール (3.252g, 38.5%) を得た。

IR (KBr) 3339, 2981, 2230, 1700, 1588, 1535, 1372, 1356, 1159, 774cm⁻¹

c) 4-シアノ-5-tert-ブトキシカルボニルアミノ-3-(2-ジメチルアミノエチル) -1-フェニル (IH) -ピラゾールの合成
4-シアノ-5-tert-ブトキシカルボニルアミノ-3-(2-ヒドロキシエチル) -1-フェニル (IH) -ピラゾール (789 mg, 2.403mmol) 、塩化メチルスルホニル (195 μl, 2.519mmol) 及びトリエチルアミン (670 μl, 4.807mmol) のジクロロメタン (40ml) 溶液を0°Cにて2.5時間撹拌した。これに水を加え、有機層を分離した後に、水層をクロロホルムにて抽出した。合わせた有機層を飽和食塩水にて洗浄後、無水硫酸ナトリウムにて乾燥後、減圧留去し残渣を得た。これをシリカゲルカラムクロマトグラフィー (クロロホルム-酢酸エチル 4:1) にて精製し、4-シアノ-5-tert-ブトキシカルボニルアミノ-3-(2-メチルスルホニルオキシエチル) -1-フェニル (IH) -ピラゾール (982 mg, 857mg) を含む残渣を得た。この残渣 (857mg) 、及び50%ジメチルアミン水溶液 (570 μl) のジメチルホルムアミド (40ml) 溶液を室

温にて2時間攪拌した。更に、5.0%ジメチルアミン水溶液 (600 μ l) を加え、室温にて2時間攪拌した。反応液に水を加え、酢酸エチルにて抽出した。有機層を飽和塩水にて洗浄後、無水硫酸ナトリウムにて乾燥後、減圧留去し残渣を得た。これをシリカゲルカラムクロマトグラフィー (クロロホルム-メタノール 97 : 3) にて精製し、4-シアノ-5-tert-ブトキシカルポニルアミノ-3- (2-ジメチルアミノエチル) -1-フェニル- (IH) -ピラゾールの (1H) -ピラゾール (650mg, 76.1%) を得た。

IR (KBr) 2983, 2786, 2232, 1731, 1597, 1575, 1504, 1456, 1395, 1369, 1280, 1256, 1160, 1012, 767 cm^{-1}

d) 5-アミノ-4-シアノ-3- (2-ジメチルアミノエチル) -1-フェニル- (IH) -ピラゾールの合成。

4-シアノ-5-tert-ブトキシカルポニルアミノ-3- (2-ジメチルアミノエチル) -1-フェニル- (IH) -ピラゾール (9.8mg, 0.026mmol) のジクロロメタン (1ml) 溶液に0℃にてトリフルオロ酢酸 (14.5 μ l, 1.892mmol) を加え、徐々に室温まで昇温しながら、9時間攪拌した。反応溶液を減圧留去し残渣を得た。有機層を飽和塩水にて洗浄し、無水硫酸ナトリウムにて乾燥後減圧留去し、残渣を得た。これを分取層クロマトグラフィー (シリカゲル, メタノール-クロロホルム-アミンアミン水 10 : 90 : 1) にて精製し、5-アミノ-4-シアノ-3- (2-ジメチルアミノエチル) -1-フェニル- (IH) -ピラゾール (1.8mg, 25.5%) を得た。

IR (KBr) 3364, 2826, 2209, 1654, 1573, 1535, 1495, 1465, 779, 697 cm^{-1}

e) 4-シアノ-3- (2-ジメチルアミノエチル) -1-フェニル-5- [3- (4-クロロベンゼンシル) -ウレイド] - (IH) -ピラゾールの合成

製造例1の方法に準じて5-アミノ-4-シアノ-3- (IH) -ピラゾールと4-クロロベンゼンシルホルミル- (IH) -ピラゾールの反応を行い、4-シアノ-3- (2-ジメチルアミノエチル) -1-フェニル-5- [3- (4-クロロベンゼンシルホルミル) -ウレイド] - (IH) -ピラゾールを合成した。融点 168-170℃

実施例 40

4-シアノ-1-フェニル-5- [3- (4-ニトロベンゼンシルホルミル) -ウレイド] - (IH) -ピラゾールの合成

5-アミノ-4-シアノ-1-フェニル- (IH) -ピラゾール (900mg, 5.212mmol) のジクロロメタン (30ml) 溶液に4-ニトロベンゼンシルホルミルイソシアナート [e

trahedron Letters, 2839, 34, (1993) より公知] (1.124g, 4.926mmol) のジクロロメタン溶液 (5ml) を0℃にて滴下した後に、0℃にて20分攪拌し、氷-水溶液を取り除き、徐々に室温まで昇温しながら100 分攪拌した。反応液を氷-水に注ぎ、クロロホルムにて抽出した。有機層を飽和塩水にて洗浄後、無水硫酸ナトリウムにて乾燥後、減圧留去し残渣を得た。これをシリカゲルカラムクロマトグラフィー (メタノール-クロロホルム 1 : 9) にて2回精製を行い、4-シアノ-1-フェニル-5- [3- (4-ニトロベンゼンシルホルミル) -ウレイド] - (IH) -ピラゾール (62mg, 3.1%) を合成した。

$^1\text{H-NMR}$ (DMSO- d_6) δ : 8.37 (2H, m), 8.20 (1H, m), 8.17 (2H, m), 7.78 (2H, m), 7.53 (2H, m), 7.42 (1H, m)

[0047] 実施例 41

4-シアノ-1-フェニル-5- [3- (4-アミノベンゼンシルホルミル) -ウレイド] - (IH) -ピラゾールの合成

4-シアノ-1-フェニル-5- [3- (4-ニトロベンゼンシルホルミル) -ウレイド] - (IH) -ピラゾール (60.0mg, 0.145mmol) と2.0%3塩化チタン水溶液 (1.20ml, 1.556mmol) のアセトン (5 ml) 溶液を7 時間室温にて攪拌した。反応液を氷-水に注ぎ、飽和塩水を加え、酢酸エチルにて抽出した。有機層を飽和塩水にて洗浄後、無水硫酸ナトリウムにて乾燥後、減圧留去し、残渣を得た。これを分取層クロマトグラフィー (シリカゲル, メタノール-酢酸エチル 1 : 10) にて精製し、4-シアノ-1-フェニル-5- [3- (4-アミノベンゼンシルホルミル) -ウレイド] - (IH) -ピラゾール (5.6 mg, 10.1%) を合成した。

IR (KBr) 3358, 2925, 1592, 1502, 1144, 1082 cm^{-1}

実施例 42

4-シアノ-3-イソプロピル-1-フェニル-5- [3- (4-トルエンシルホルミル) -ウレイド] - (IH) -ピラゾールの合成

a) イソプロピルヒドロキシメチレンマロノニトリルの合成

マロノニトリル (2.591 グラム, 39.222mmol) およびトリエチルアミン (7.986g, 78.921mmol) のベンゼン (50ml) 溶液に0℃にて塩化イソプロピル (4.084g, 38.329mmol) を滴下した。氷-水溶液を取り除き、徐々に室温まで昇温しながら、2時間攪拌した。反応液に水を加え、酢酸エチルにて抽出した。この有機層を無水硫酸ナトリウムにて乾燥し、減圧留去して、イソプロピルヒドロキシメチレンマロノニトリル (4.894 g, 94.5%) を得た。

IR (KBr) 3202, 2983, 2242, 2228, 1560, 1464, 1253, 1095, 980 cm^{-1}

b) イソプロピルヒドロキシメチレンマロノニトリルの合成

イソプロピルヒドロキシメチレンマロノニトリル (4.307g, 31.869mmol), 硫酸ジメチル (10ml, 105.665mmol), 酢酸ナトリウム (10.375g, 97.887mmol) および水 (8ml) の1, 4-ジオキサラン (75ml) 溶液を70-80℃にて6時間加熱還流した。反応液を氷-水に注ぎ、酢酸エチルにて抽出した。有機層を飽和塩水にて洗浄後、減圧留去し残渣を得た。これをシリカゲルカラムクロマトグラフィー (ヘキサン-酢酸エチル 10 : 1) にて精製し、イソプロピルヒドロキシメチレンマロノニトリル (1.470g, 30.7%) を得た。

IR (neat) 2990, 2225, 1570, 1470, 1335, 1215, 1110 cm^{-1}

c) 5-アミノ-4-シアノ-3-イソプロピル-1-フェニル- (IH) -ピラゾールの合成

イソプロピルヒドロキシメチレンマロノニトリル (937mg, 6.239mmol) およびフェニルヒドラジン (681mg, 6.301mmol) のエタノール (20ml) 溶液を3 時間加熱還流した。冷却後、エタノールを減圧留去し残渣を得た。これをシリカゲルカラムクロマトグラフィー (ヘキサン-酢酸エチル 10 : 1-3 : 1) にて精製し、5-アミノ-4-シアノ-3-イソプロピル-1-フェニル- (IH) -ピラゾール (1.370g, 97.0%) を得た。

IR (KBr) 3364, 2826, 2209, 1654, 1573, 1535, 1495, 1465, 779, 697 cm^{-1}

d) 4-シアノ-3-イソプロピル-1-フェニル-5- [3- (4-トルエンシルホルミル) -ウレイド] - (IH) -ピラゾールの合成

製造例1の方法に準じて5-アミノ-4-シアノ-3-イソプロピル-1-フェニル- (IH) -ピラゾールと4-トルエンシルホルミルイソシアナートより、反応を行い、4-シアノ-3-イソプロピル-1-フェニル-5- [3- (4-トルエンシルホルミル) -ウレイド] - (IH) -ピラゾールを合成した。融点 161-163℃

実施例 43

4-シアノ-3-イソプロピル-1-フェニル-5- [3- (4-クロロベンゼンシルホルミル) -ウレイド] - (IH) -ピラゾールの合成

製造例1の方法に準じて5-アミノ-4-シアノ-3-イソプロピル-1-フェニル- (IH) -ピラゾールと4-クロロベンゼンシルホルミルイソシアナートより、反応を行い、4-シアノ-3-イソプロピル-1-フェニル-5- [3- (4-クロロベンゼンシルホルミル) -ウレイド] - (IH) -ピラゾールを合成した。

IR (KBr) 3324, 2972, 2233, 1720, 1582, 1508, 1468, 1159, 1091 cm^{-1}

[0048] 実施例 44

4-シアノ-3-メチル-1-フェニル-5- [3-

(4-クロロベンゼンシルホルミル) -ウレイド] - (IH) -ピラゾールのナトリウム塩の合成

4-シアノ-3-メチル-1-フェニル-5- [3- (4-クロロベンゼンシルホルミル) -ウレイド] - (IH) -ピラゾール (388mg, 0.750mmol) を水 (40ml) に懸濁し、室温で攪拌しながら1N 水酸化ナトリウム水溶液を750 μ l 加え、1時間攪拌した。不溶物を濾取し、濾液を減圧留去し、4-シアノ-3-メチル-1-フェニル-5- [3- (4-クロロベンゼンシルホルミル) -ウレイド] - (IH) -ピラゾールのナトリウム塩 (327mg, 80.0%) を得た。

IR (KBr) 3411, 2230, 1638, 1572, 1535, 1497, 1395, 1307, 1257, 1148, 1074 cm^{-1}

実施例 45

4-シアノ-3-メチル-1-フェニル-5- [3- (4-トルエンシルホルミル) -ウレイド] - (IH) -ピラゾールのナトリウム塩の合成

製造例44の方法に準じて4-シアノ-3-メチル-1-フェニル-5- [3- (4-トルエンシルホルミル) -ウレイド] - (IH) -ピラゾールより4-シアノ-3-メチル-1-フェニル-5- [3- (4-トルエンシルホルミル) -ウレイド] - (IH) -ピラゾールのナトリウム塩を得た。

IR (KBr) 3422, 2229, 1640, 1536, 1497, 1307, 1260, 1145, 1074 cm^{-1}

実施例 46

4-シアノ-1-シクロヘキシル-5- [3- (4-トルエンシルホルミル) -ウレイド] - (IH) -ピラゾールのナトリウム塩の合成

製造例44の方法に準じて4-シアノ-1-シクロヘキシル-5- [3- (4-トルエンシルホルミル) -ウレイド] - (IH) -ピラゾールより4-シアノ-1-シクロヘキシル-5- [3- (4-トルエンシルホルミル) -ウレイド] - (IH) -ピラゾールを合成した。

IR (KBr) 3399, 2931, 2856, 2236, 1629, 1575, 1455, 1275, 1144, 1099 cm^{-1}

実施例 47

4-シアノ-1-フェニル-5- [3- (4-イソプロピルベンゼンシルホルミル) -ウレイド] - (IH) -ピラゾールの合成

5-アミノ-4-シアノ-1-フェニル- (IH) -ピラゾール [J. Org. Chem. 1240, 21, (1956) より公知] (354mg, 1.922mmol) のジクロロメタン (10ml) に4-イソプロピルベンゼンシルホルミルイソシアナート [ドイツ特許1289526 より公知] のクメン (2ml) 溶液を0℃にて滴下した。0℃にて20分攪拌した後、氷-水溶液を取り除き、徐々に室温まで昇温しながら、100 分攪拌した。反応液を減圧留去し、残渣を得た。これをシ

【0052】実施例 56
5-[3-ベンジル-3-(4-クロロベンゼンスルホニル)-4-シアノ-3-メチル-1-フエニル]-ウレイド-4-シアノ-3-メチル-1-フエニル (1H)-ピラゾールの合成
5-シアノ-3-メチル-1-フエニル-5-[3-(4-クロロベンゼンスルホニル)-ウレイド]-1H)-ピラゾールのナトリウム塩 (200mg, 0.457mmol)、臭化ベンジルの (85μl, 0.546mmol)、硫酸テトラ-*n*-ブチルアンモニウム (30mg, 0.0894mmol) を水、酸化ナトリウム水溶液 (20ml) とトルエン (20ml) の混合溶液中、100℃にて2時間加熱撹拌した。冷却後、H₂Oを加え、pH 7となした後に酢酸エチルにて抽出した。酢酸を加え、飽和食塩水にて洗浄し、硫酸ナトリウムにて乾

b) 4-プロモベンゼンスルホンアミドのナトリウム塩の合成

IR (KBr) 3213, 1154, 1118, 991, 820 cm^{-1}
 c) 5-[3-(4-プロモベンゼンスルホニル)-
 レイド]-4-シアノ-3-メチル-1-フェニル-
 (1H)-ピラゾールの合成

5-(N-メチルギキシルポニルプロピルアミノ)-
4-シアノ-3-メル-1-ブエニル-(1H)-
ラゾール (83mg, 0.278mmol) および50%水酸化カリウム
水溶液 (2.0ml) のジエチレングリコール (5.0ml) 溶
液を100℃にて3.5時間攪拌した。これを氷-水に注ぎ、
酢酸エチルにて抽出し、有機層を飽和食塩水にて洗浄、

アノ-3-メチル-1-フエニル (1H) -ピラゾールの合成

製造例1の方法に準じて5-(2-ジメチルアミノエチルアミノ)-4-シアノ-3-メチル-1-フエニル (1H) -ピラゾールと4-クロロベンゼンスルホニル (1H) -ピラゾールと4-クロロベンゼンスルホニルイソシアナートより、反応を行い、5-[3-(4-クロロベンゼンスルホニル)-1-(2-ジメチルアミノエチル)-ウレイド]-4-シアノ-3-メチル-1-フエニル (1H) -ピラゾールを合成した。融点 93-96°C

[0054] 実施例60

5-[3-(4-クロロベンゼンスルホニル)-1-(2-(4-モルホリノ)-エチル)-ウレイド]-4-シアノ-3-メチル-1-フエニル (1H) -ピラゾールの合成

5-[N-メトキシカルボニル-12-(4-モルホリノ)-エチル]アミノ]-4-シアノ-3-メチル-1-フエニル (1H) -ピラゾールの合成

製造例58a)の方法に準じて、5-(N-メトキシカルボニルアミノ)-4-シアノ-3-メチル-1-フエニル (1H) -ピラゾール、4-(2-クロロエチル)モルホリン塩酸塩より、5-[N-メトキシカルボニル-12-(4-モルホリノ)-エチル]アミノ]-4-シアノ-3-メチル-1-フエニル (1H) -ピラゾールを合成した。

¹H-NMR (CDCl₃) 7.39-7.54 (5H, m), 3.81 (1H, m), 3.66 (3H, s), 3.60 (4H, m), 3.25 (1H, m), 2.45 (3H, s), 2.35 (4H, m), 2.35-2.50 (2H, m), 2.14 (6H, s)

b) 5-[12-(4-モルホリノ)-エチルアミノ]-4-シアノ-3-メチル-1-フエニル (1H) -ピラゾールの合成

製造例58b)の方法に準じて、5-(N-メトキシカルボニル-12-(4-モルホリノ)-エチル)アミノ]-4-シアノ-3-メチル-1-フエニル (1H) -ピラゾールより、5-[12-(4-モルホリノ)-エチルアミノ]-4-シアノ-3-メチル-1-フエニル (1H) -ピラゾールを合成した。

¹H-NMR (CDCl₃) 7.40-7.55 (5H, m), 5.41 (1H, m), 3.52-3.59 (6H, m), 2.59 (2H, m), 2.41 (4H, m), 2.33 (3H, s)

c) 5-[3-(4-クロロベンゼンスルホニル)-12-(4-モルホリノ)-エチル]-ウレイド]-4-シアノ-3-メチル-1-フエニル (1H) -ピラゾールの合成

製造例1の方法に準じて5-[2-(4-モルホリノ)-エチルアミノ]-4-シアノ-3-メチル-1-フエニル (1H) -ピラゾールと4-クロロベンゼンスルホニルイソシアナートより、反応を行い、5-[3-(4-クロロベンゼンスルホニル)-1-(2-

リノ)-エチル]-ウレイド]-4-シアノ-3-メチル-1-フエニル (1H) -ピラゾールを合成した。融点 143-155°C

[0055] 実施例61

5-[3-(4-クロロベンゼンスルホニル)ウレイド]-4-シアノ-3-メチル-1-(1-メチルピペリジン-4-イル) (1H) -ピラゾールの合成

a) 5-[ジ-(tert-ブトキシカルボニル)-アミノ]-4-シアノ-3-メチル-1-(1-ベンジルピペリジン-4-イル) (1H) -ピラゾールの合成

5-アミノ-4-シアノ-3-メチル-1-(1-ベンジルピペリジン-4-イル) (1H) -ピラゾール (300mg, 1.015mmol) のジクロロメタン (20ml) 溶液に室温にてジ-tert-ブトキシカルボナート (280μl, 3.235mmol) を加え、1時間攪拌した。これを氷-水に注ぎ、酢酸エチルにて抽出し、有機層を飽和食塩水にて洗浄、硫酸ナトリウムにて乾燥後、減圧留去し残渣を得た。これをシリカゲルカラムクロマトグラフィー (メタノール-クロロホルム 10:9) にて精製し、5-(ジ-(tert-ブトキシカルボニル)-アミノ)-4-シアノ-3-メチル-1-(1-ベンジルピペリジン-4-イル) (1H) -ピラゾール (500mg, 定量的) を合成した。

¹H-NMR (CDCl₃) 7.22-7.35 (5H, m), 3.81 (1H, m), 3.53 (2H, s), 3.00 (2H, m), 2.36 (2H, s), 2.19-2.33 (2H, m), 2.01-2.12 (2H, m), 1.75 (2H, m), 1.45 (18H, s)

b) 5-(N-tert-ブトキシカルボニルアミノ)-4-シアノ-3-メチル-1-(1-ベンジルピペリジン-4-イル) (1H) -ピラゾールの合成

5-(ジ-(tert-ブトキシカルボニル)-アミノ)-4-シアノ-3-メチル-1-(1-ベンジルピペリジン-4-イル) (1H) -ピラゾール (384mg, 0.775mmol) 、1H水酸化カリウム水溶液 (3.0ml) のエタノール (20ml) 溶液を室温にて4時間攪拌した。冷却後、1N塩酸を加え、pH 7とした後にエタノールを減圧留去した。これに水を加え、酢酸エチルにて抽出した。有機層を飽和食塩水にて洗浄し、硫酸ナトリウムにて乾燥後、減圧留去し残渣を得た。これをシリカゲルカラムクロマトグラフィー (メタノール-クロロホルム 10:9) にて精製し、5-(N-tert-ブトキシカルボニルアミノ)-4-シアノ-3-メチル-1-(1-ベンジルピペリジン-4-イル) (1H) -ピラゾール (290mg, 94.6%) を得た。

¹H-NMR (CDCl₃) 7.21-7.35 (5H, m), 6.36 (1H, brs), 3.97 (1H, m), 3.54 (2H, s), 3.01 (2H, m), 2.33 (3H, s), 2.03-2.30 (4H, m), 1.84 (2H, m), 1.51 (9H, s)

c) 5-(N-tert-ブトキシカルボニルアミノ)-4-シアノ-3-メチル-1-(1-ベンジルピペリジン-4-イル) (1H) -ピラゾールの合成

5-(N-tert-ブトキシカルボニルアミノ)-4-シアノ-3-メチル-1-(1-ベンジルピペリジン-4-イル) (1H) -ピラゾール (95mg, 0.240mmol) 、10%パラジウム-炭素 (5.0mg) 、ギ酸アンモニウム (60.0mg, 0.951mmol) のエタノール (10ml) 溶液を4時間加熱還流した。冷却後、セライトを用い濾過し、減圧留去し残渣を得た。これをシリカゲルカラムクロマトグラフィー (メタノール-クロロホルム 10:90) にて精製し、5-(N-tert-ブトキシカルボニルアミノ)-4-シアノ-3-メチル-1-(1-ベンジルピペリジン-4-イル) (1H) -ピラゾール (73mg, 定量的) を合成した。

¹H-NMR (CDCl₃) 4.32 (81H, m), 3.29-3.35 (2H, m), 2.83-2.93 (2H, m), 2.30 (3H, s), 1.93-2.26 (4H, m)

d) 5-(N-tert-ブトキシカルボニルアミノ)-4-シアノ-3-メチル-1-(1-メチルピペリジン-4-イル) (1H) -ピラゾールの合成

5-(N-tert-ブトキシカルボニルアミノ)-4-シアノ-3-メチル-1-(1-ベンジルピペリジン-4-イル) (1H) -ピラゾール (90mg, 0.295mmol) 、ヨードメタン (25μl, 0.402mmol) 、硫酸カリウム (220mg, 1.592mmol) のジメチルホルムアミド (5.0ml) 溶液を室温にて3時間攪拌した。これを氷-水に注ぎ、酢酸エチルにて抽出し、有機層を飽和食塩水にて洗浄、硫酸ナトリウムにて乾燥後、減圧留去し残渣を得た。これをシリカゲルカラムクロマトグラフィー (メタノール-クロロホルム 5:95) にて精製し、5-(N-tert-ブトキシカルボニルアミノ)-4-シアノ-3-メチル-1-(1-メチルピペリジン-4-イル) (1H) -ピラゾール (19mg, 20.2%) を合成した。

¹H-NMR (CDCl₃) 3.20, 2.97, 2.29, 1.72, 1.58, 1.45, 1.37, 1.25, 1.160cm⁻¹

e) 5-アミノ-4-シアノ-3-メチル-1-(1-メチルピペリジン-4-イル) (1H) -ピラゾールの合成

5-(N-tert-ブトキシカルボニルアミノ)-4-シアノ-3-メチル-1-(1-メチルピペリジン-4-イル) (1H) -ピラゾール (17mg, 0.0532mmol) のジクロロメタン (2.0ml) 溶液に0°Cにてトリフルオロタンソルホン酸 (200μl) を加え、2時間攪拌した。反応液を減圧留去し、残渣を得た。これにアンモニウム水を加え、酢酸エチルにて抽出し、有機層を飽和食塩水にて洗浄、硫酸ナトリウムにて乾燥後、減圧留去し残渣を得た。これをシリカゲルカラムクロマトグラフィー (シリカゲル、メタノール-クロロホルム 10:90) にて精製し、5-アミノ-4-シアノ-3-メチル-1-(1-メチルピ

ペリジン-4-イル) (1H) -ピラゾール (5.6mg, 48.2%) を合成した。

¹H-NMR (CDCl₃) 4.23 (2H, brs), 3.74 (1H, m), 2.99 (2H, m), 2.32 (3H, s), 2.23 (3H, s), 2.03-2.25 (4H, m), 1.83-1.89 (2H, m)

f) 5-[3-(4-クロロベンゼンスルホニル)ウレイド]-4-シアノ-3-メチル-1-(1-メチルピペリジン-4-イル) (1H) -ピラゾールの合成

製造例1の方法に準じて5-アミノ-4-シアノ-3-メチル-1-(1-メチルピペリジン-4-イル) (1H) -ピラゾールと4-クロロベンゼンスルホニルイソシアナートより、反応を行い、5-[3-(4-クロロベンゼンスルホニル)ウレイド]-4-シアノ-3-メチル-1-(1-メチルピペリジン-4-イル) (1H) -ピラゾールを合成した。

¹H-NMR (CDCl₃) 4.32 (81H, m), 3.29-3.35 (2H, m), 2.83-2.93 (2H, m), 2.30 (3H, s), 1.93-2.26 (4H, m)

製造例44の方法に準じて5-[3-(4-クロロベンゼンスルホニル)ウレイド]-3-メチル-1-フエニル (1H) -ピラゾールのナトリウム塩の合成

製造例44の方法に準じて5-[3-(4-クロロベンゼンスルホニル)ウレイド]-3-メチル-1-フエニル (1H) -ピラゾールより5-[3-(4-クロロベンゼンスルホニル)ウレイド]-3-メチル-1-フエニル (1H) -ピラゾールのナトリウム塩を得た。

¹H-NMR (CDCl₃) 3.419, 1.622, 1.539, 1.502, 1.478, 1.365, 1.28, 1.137, 1.088, 1.070, 1.013, 826, 755, 643, 622cm⁻¹

製造例63

5-[3-(4-クロロベンゼンスルホニル)ウレイド]-4-シアノ-3-メチル-1-(2-tert-ブトキシカルボニルオキシエチル) (1H) -ピラゾールの合成

a) 5-アミノ-4-シアノ-3-メチル-1-(2-tert-ブトキシカルボニルオキシエチル) (1H) -ピラゾールの合成

4-シアノ-3-メチル-1-(2-tert-ブトキシカルボニルオキシエチル) (1H) -ピラゾール [J. Hetero cycl. Chem., 1199, 12, (1975) より公知] (2.273g, 13.678mmol) 、ジ-tert-ブチルカルボナート (3.80ml, 16.542mmol) をジクロロメタン (10ml) -テトラヒドロフラン (90ml) の混合溶液中、室温にて時間攪拌した。これを氷-水に注ぎ、酢酸エチルにて抽出し、有機層を飽和食塩水にて洗浄、硫酸ナトリウムにて乾燥後、減圧留去し残渣を得た。これをシリカゲルカラムクロマトグラフィー (メタノール-クロロホルム 3:97) にて精製し、5-アミノ-4-シアノ-3-メチル-1-(2-tert-ブトキシカルボニルオキシエチル) (1H) -ピラゾール (947mg, 25.9%) を得た。

¹H-NMR (DMSO-d₆) 6.54 (2H, brs), 4.23 (2H, t, J=

5.3Hz), 4.06 (2H, t, J=5.3Hz), 2.05 (3H, s), 1.39 (9H, s)

b) 5-[3-(4-クロロベンゼンスルホニル)ウレイド]-4-シアノ-3-メチル-1-(2-tert-ブトキシカルボニルオキシエチル)-(1H)-ピラゾールの合成

製造例1の方法に準じて5-アミノ-4-シアノ-3-メチル-1-(2-tert-ブトキシカルボニルオキシエチル)-(1H)-ピラゾールと4-クロロベンゼンスルホニルイソシアナートより反応を行い、5-[3-(4-クロロベンゼンスルホニル)ウレイド]-4-シアノ-3-メチル-1-(2-tert-ブトキシカルボニルオキシエチル)-(1H)-ピラゾールを合成した。融点 144-146°C

【0057】実施例64

5-[3-(4-クロロベンゼンスルホニル)ウレイド]-4-シアノ-3-メチル-1-(2-ビドロキシエチル)-(1H)-ピラゾールの合成

5-[3-(4-クロロベンゼンスルホニル)ウレイド]-4-シアノ-3-メチル-1-(2-tert-ブトキシカルボニルオキシエチル)-(1H)-ピラゾール (69mg, 0.142mmol) および1N水酸化ナトリウム水溶液 (2.0ml) のエタノール (5.0ml) 溶液を室温にて3.0時間攪拌した。冷却後、1N塩酸を加え、pH 7とした後にエタノールを減圧留去した。これに水を加え、酢酸エチルにて抽出した。有機層を飽和食塩水にて洗浄、硫酸ナトリウムにて乾燥後、減圧留去し残渣を得た。これをシリカゲルカラムクロマトグラフィー (メタノール/クロロホルム 10:90) にて精製し、5-[3-(4-クロロベンゼンスルホニル)ウレイド]-4-シアノ-3-メチル-1-(2-ビドロキシエチル)-(1H)-ピラゾール (32mg, 58.7%) を得た。

IR (KBr) 3401, 2925, 2853, 2231, 1736, 1618, 1572, 1478, 1260, 1146, 1088, 1014, 756, 628cm⁻¹

実施例65

5-[3-(4-クロロベンゼンスルホニル)ウレイド]-4-シアノ-3-メチル-1-(2-tert-ブトキシカルボニルオキシエチル)-(1H)-ピラゾールの合成

a) 5-[N-メトキシカルボニル]-(2-tert-ブトキシエチル)アミノ]-4-シアノ-3-メチル-1-フェニル-1-(1H)-ピラゾールの合成

製造例58a)の方法に準じて5-(N-メトキシカルボニル)アミノ]-4-シアノ-3-メチル-1-フェニル-1-(1H)-ピラゾールとクロロエチルメチルエーテルより反応を行い、5-[N-メトキシカルボニル]-(2-tert-ブトキシエチル)アミノ]-4-シアノ-3-メチル-1-フェニル-1-(1H)-ピラゾールを合成した。

IR-NMR 7.38-7.51 (5H, m), 3.30-3.90 (7H, m), 3.25 (3H, s), 2.44 (3H, s)

b) 5-(2-メトキシエチルアミノ)-4-シアノ-3-メチル-1-(2-tert-ブトキシカルボニルオキシエチル)-(1H)-ピラゾールの合成

製造例58a)の方法に準じて5-(N-メトキシカルボニル)アミノ]-4-シアノ-3-メチル-1-フェニル-1-(1H)-ピラゾールとクロロエチルメチルエーテルより反応を行い、5-[N-メトキシカルボニル]-(2-tert-ブトキシエチル)アミノ]-4-シアノ-3-メチル-1-フェニル-1-(1H)-ピラゾールを合成した。

IR-NMR 7.38-7.51 (5H, m), 3.30-3.90 (7H, m), 3.25 (3H, s), 2.44 (3H, s)

b) 5-(2-メトキシエチルアミノ)-4-シアノ-3-メチル-1-(2-tert-ブトキシカルボニルオキシエチル)-(1H)-ピラゾールの合成

製造例58a)の方法に準じて5-(N-メトキシカルボニル)アミノ]-4-シアノ-3-メチル-1-フェニル-1-(1H)-ピラゾールとクロロエチルメチルエーテルより反応を行い、5-[N-メトキシカルボニル]-(2-tert-ブトキシエチル)アミノ]-4-シアノ-3-メチル-1-フェニル-1-(1H)-ピラゾールを合成した。

ンスルホニルオキシエチル)-(1H)-ピラゾール (52mg, 2.141mmol), 1, 8-ジアザビシクロ [5, 4, 0,]-7-ウンデセン (960μl, 6.424mmol) のテトラヒドロフラン (20ml) 溶液を6時間加熱還流した。冷却後、氷-水に注ぎ、酢酸エチルにて抽出し、有機層を飽和食塩水にて洗浄、硫酸ナトリウムにて乾燥後、減圧留去し残渣を得た。これをシリカゲルカラムクロマトグラフィー (クロロホルム-酢酸エチル 4:1) にて精製し、5-アミノ-4-シアノ-3-メチル-1-フェニル-1-(1H)-ピラゾール (73mg, 23.0%) を合成した。

IR-NMR (CDCl₃) 6.71 (1H, dd, J=8.9, 15.5Hz), 5.60 (1H, dd, J=1.0, 15.5Hz), 4.98 (1H, dd, J=1.0, 8.9Hz), 4.64 (2H, brs), 2.28 (3H, s)

c) 5-[3-(4-クロロベンゼンスルホニル)ウレイド]-4-シアノ-3-メチル-1-フェニル-1-(1H)-ピラゾールの合成

製造例1の方法に準じて4-シアノ-3-メチル-1-フェニル-1-(1H)-ピラゾールと4-クロロベンゼンスルホニルイソシアナートより反応を行い、5-[3-(4-クロロベンゼンスルホニル)ウレイド]-4-シアノ-3-メチル-1-フェニル-1-(1H)-ピラゾールを合成した。融点 184-187°C

【0059】実施例67

5-[3-(4-クロロベンゼンスルホニル)ウレイド]-4-シアノ-3-メチル-1-エチル-1-(1H)-ピラゾールの合成

a) 5-アミノ-4-シアノ-3-メチル-1-エチル-1-(1H)-ピラゾールの合成

5-アミノ-4-シアノ-3-メチル-1-フェニル-1-(1H)-ピラゾール (36mg, 0.243mmol), 10%パラジウム-炭素 (10mg) の酢酸エチル (3.0ml) 懸濁液を水素ガス雰囲気下、室温にて1時間攪拌した。濾過後、濾液を減圧留去し、残渣を得た。これをシリカゲルカラムクロマトグラフィー (クロロホルム-酢酸エチル 4:1) にて精製し、5-アミノ-4-シアノ-3-メチル-1-エチル-1-(1H)-ピラゾール (28mg, 76.7%) を合成した。

b) 5-[3-(4-クロロベンゼンスルホニル)ウレイド]-4-シアノ-3-メチル-1-エチル-1-(1H)-ピラゾールの合成

製造例1の方法に準じて5-アミノ-4-シアノ-3-メチル-1-フェニル-1-(1H)-ピラゾールと4-クロロベンゼンスルホニルイソシアナートより反応を行い、5-[3-(4-クロロベンゼンスルホニル)ウレイド]-4-シアノ-3-メチル-1-フェニル-1-(1H)-ピラゾールを合成した。

IR (KBr) 3436, 2930, 2232, 1587, 1380, 1310, 1263, 1137, 1089, 754, 632cm⁻¹

【0058】実施例66

5-[3-(4-クロロベンゼンスルホニル)ウレイド]-4-シアノ-3-メチル-1-フェニル-1-(1H)-ピラゾールの合成

a) 5-アミノ-4-シアノ-3-メチル-1-(2-メタンスルホニルオキシエチル)-(1H)-ピラゾールの合成

5-アミノ-4-シアノ-3-メチル-1-(2-ビドロキシエチル)-(1H)-ピラゾール [J. Heterocycl. Chem., 1199, 12, (1975) より公知] (2.210g, 13.299mmol), 塩化メタンスルホニル (1.30ml, 16.796mmol), トリエチルアミン (4.0ml, 28.698mmol) をジクロメタン (10ml) にテトラヒドロフラン (90ml) 混合溶液中、室温にて1時間攪拌した。これを氷-水に注ぎ、酢酸エチルにて抽出し、有機層を飽和食塩水にて洗浄、硫酸ナトリウムにて乾燥後、減圧留去し残渣を得た。これをシリカゲルカラムクロマトグラフィー (メタノール/クロロホルム 3:97) にて精製し、5-アミノ-4-シアノ-3-メチル-1-(2-メタンスルホニルオキシエチル)-(1H)-ピラゾール (1.097g, 33.8%) を合成した。

IR-NMR (DMSO-d₆) 6.61 (2H, brs), 4.43 (2H, t, J=5.3Hz), 4.16 (2H, t, J=5.3Hz), 3.09 (3H, s), 2.08 (3H, s)

b) 5-アミノ-4-シアノ-3-メチル-1-フェニル-1-(1H)-ピラゾールの合成

製造例58a)の方法に準じて5-(N-メトキシカルボニル)アミノ]-4-シアノ-3-メチル-1-フェニル-1-(1H)-ピラゾールとクロロエチルメチルエーテルより反応を行い、5-[N-メトキシカルボニル]-(2-tert-ブトキシエチル)アミノ]-4-シアノ-3-メチル-1-フェニル-1-(1H)-ピラゾールを合成した。

IR-NMR 7.38-7.51 (5H, m), 3.30-3.90 (7H, m), 3.25 (3H, s), 2.44 (3H, s)

b) 5-(2-メトキシエチルアミノ)-4-シアノ-3-メチル-1-(2-tert-ブトキシカルボニルオキシエチル)-(1H)-ピラゾールの合成

製造例58a)の方法に準じて5-(N-メトキシカルボニル)アミノ]-4-シアノ-3-メチル-1-フェニル-1-(1H)-ピラゾールとクロロエチルメチルエーテルより反応を行い、5-[N-メトキシカルボニル]-(2-tert-ブトキシエチル)アミノ]-4-シアノ-3-メチル-1-フェニル-1-(1H)-ピラゾールを合成した。

IR (KBr) 3430, 1602, 1541, 1501, 1385, 1301, 1274, 1122, 771, 694cm⁻¹

【0060】実施例70

5-[3-(4-エチルベンゼンスルホニル)ウレイド]-4-シアノ-3-メチル-1-フェニル-1-(1H)-ピラゾールの合成

d) 5-[3-(4-シアノ-3-メチル-1-(2-メトキシカルボニルオキシエチル)-(1H)-ピラゾール)ウレイド]-4-シアノ-3-メチル-1-(2-tert-ブトキシカルボニルオキシエチル)-(1H)-ピラゾールの合成

5-アミノ-4-シアノ-3-メチル-1-(2-メタンスルホニルオキシエチル)-(1H)-ピラゾール (189mg, 0.774mmol), ナトリウムメトキシド (210mg, 3.887mmol) のメタノール (5.0ml) 溶液を室温にて6時間攪拌した。メタノールを減圧留去し残渣を得た。これを酢酸エチルにて抽出し、有機層を飽和食塩水にて洗浄、硫酸ナトリウムにて乾燥後、減圧留去し残渣を得た。これをシリカゲルカラムクロマトグラフィー (メタノール/クロロホルム 1:99) にて精製し、5-アミノ-4-シアノ-3-メチル-1-(2-メトキシエチル)-(1H)-ピラゾール (77mg, 65.2%) を合成した。

IR-NMR (CDCl₃) 4.85 (2H, brs), 4.08 (2H, m), 3.68 (2H, m), 3.37 (3H, s), 2.23 (3H, s)

b) 5-[3-(4-クロロベンゼンスルホニル)ウレイド]-4-シアノ-3-メチル-1-(2-メトキシエチル)-(1H)-ピラゾールの合成

製造例1の方法に準じて5-アミノ-4-シアノ-3-メチル-1-(2-メトキシエチル)-(1H)-ピラゾールと4-クロロベンゼンスルホニルイソシアナートより反応を行い、5-[3-(4-クロロベンゼンスルホニル)ウレイド]-4-シアノ-3-メチル-1-(2-メトキシエチル)-(1H)-ピラゾールを合成した。融点 196-199°C

実施例69

5-[3-(2-ナフチルスルホニル)ウレイド]-4-シアノ-3-メチル-1-フェニル-1-(1H)-ピラゾールの合成

製造例1の方法に準じて5-アミノ-4-シアノ-3-メチル-1-(2-メトキシエチル)-(1H)-ピラゾールと2-ナフチルスルホニルイソシアナート [DE1289526 より公知] より合成を行い、5-[3-(2-ナフチルスルホニル)ウレイド]-4-シアノ-3-メチル-1-(1H)-ピラゾールを合成した。

IR (KBr) 3430, 1602, 1541, 1501, 1385, 1301, 1274, 1122, 771, 694cm⁻¹

【0060】実施例70

5-[3-(4-エチルベンゼンスルホニル)ウレイド]-4-シアノ-3-メチル-1-フェニル-1-(1H)-ピラゾールの合成

製造例1の方法に準じて5-アミノ-4-シアノ-3-メチル-1-フェニル-1-(1H)-ピラゾール [J. Org. Chem., 6155, 58, (1993) より公知] と2-ナフチルスルホニルイソシアナート [DE1289526 より公知] より合成を行い、5-[3-(2-ナフチルスルホニル)ウレイド]-4-シアノ-3-メチル-1-(1H)-ピラゾールを合成した。

IR (KBr) 3430, 1602, 1541, 1501, 1385, 1301, 1274, 1122, 771, 694cm⁻¹

【0060】実施例70

5-[3-(4-エチルベンゼンスルホニル)ウレイド]-4-シアノ-3-メチル-1-フェニル-1-(1H)-ピラゾールの合成

製造例1の方法に準じて5-アミノ-4-シアノ-3-メチル-1-フェニル-1-(1H)-ピラゾールと4-エチルベンゼンスルホニルイソシアナート [DE1289526 より公知] より合成を行い、5-[3-(4-エチルベンゼンスルホニル)ウレイド]-4-シアノ-3-メチル-1-(1H)-ピラゾールを合成した。

IR (KBr) 3430, 1602, 1541, 1501, 1385, 1301, 1274, 1122, 771, 694cm⁻¹

【0060】実施例70

5-[3-(4-エチルベンゼンスルホニル)ウレイド]-4-シアノ-3-メチル-1-フェニル-1-(1H)-ピラゾールの合成

製造例1の方法に準じて5-アミノ-4-シアノ-3-メチル-1-フェニル-1-(1H)-ピラゾールと4-エチルベンゼンスルホニルイソシアナート [DE1289526 より公知] より合成を行い、5-[3-(4-エチルベンゼンスルホニル)ウレイド]-4-シアノ-3-メチル-1-(1H)-ピラゾールを合成した。

IR (KBr) 3430, 1602, 1541, 1501, 1385, 1301, 1274, 1122, 771, 694cm⁻¹

【0060】実施例70

5-[3-(4-エチルベンゼンスルホニル)ウレイド]-4-シアノ-3-メチル-1-フェニル-1-(1H)-ピラゾールの合成

製造例1の方法に準じて5-アミノ-4-シアノ-3-メチル-1-フェニル-1-(1H)-ピラゾールと4-エチルベンゼンスルホニルイソシアナート [DE1289526 より公知] より合成を行い、5-[3-(4-エチルベンゼンスルホニル)ウレイド]-4-シアノ-3-メチル-1-(1H)-ピラゾールを合成した。

IR (KBr) 3430, 1602, 1541, 1501, 1385, 1301, 1274, 1122, 771, 694cm⁻¹

ラゾールを合成した。

IR (KBr) 3537, 1732, 1584, 1503, 1468, 1334, 1115
4, 1090, 1026, 922, 752, 658cm⁻¹

実施例 71

5-(3-メチルスルホニル)ウレイド-4-シアノ-3-メチル-1-フェニル (1H)-ピラゾールの合成

成

a) メタンズルホンアミドのナトリウム塩の合成

実施例 57b) の方法に準じてメタンズルホンアミドより、メタンズルホンアミドのナトリウム塩を合成した。

IR (KBr) 3440, 1652, 1352, 1318, 1213, 1136, 996cm⁻¹

-1

b) 5-(3-メチルスルホニル)ウレイド-4-シアノ-3-メチル-1-フェニル (1H)-ピラゾールの合成

5-(N-メトキシカルボニル)アミノ-4-シアノ-3-メチル-1-フェニル (1H)-ピラゾール (32mg, 1.260mmol)、メタンズルホンアミドのナトリウム塩 (736mg, 6.302mmol) のテトラヒドロフラン (20ml) 溶液を 9 時間加熱還流した。冷却後、テトラヒドロ

フランを減圧留去し、残渣を得た。これをクロロホルムを加え、続いて N 塩酸を加え、pH 3 とした。クロロホルム層を分離し、これを飽和食塩水にて洗浄、硫酸ナトリウムにて乾燥後、減圧留去し残渣を得た。これをシリカゲルカラムクロマトグラフィー (クロロホルム-酢酸エチル 4:1) でメタノール-クロロホルム 10:90 に

て精製し、5-(3-メチルスルホニル)ウレイド-4-シアノ-3-メチル-1-フェニル (1H)-ピラゾール (35mg, 8.7%) を得た。

IR (KBr) 3436, 2232, 1611, 1501, 1312, 1252, 1114, 1114, 968, 768, 696cm⁻¹

実施例 72

5-(3-(4-イソプロピルベンゼンスルホニル)ウレイド)-3-メチル-1-フェニル (1H)-ピラゾールの合成

製造例 1 の方法に準じて 5-アミノ-3-メチル-1-フェニル (1H)-ピラゾール [J. Org. Chem., 615

5, 58, (1993) より公知] と 4-イソプロピルベンゼンスルホニルイソシアナート [DE1289526 より公知] より

合成を行い、5-(3-(4-イソプロピルベンゼンスルホニル)ウレイド)-3-メチル-1-フェニル (1H)-ピラゾール (1H)-ピラゾールの合成した。

IR (KBr) 3536, 2958, 1734, 1598, 1564, 1502, 146

7, 1334, 1154, 1090, 1027, 921, 754, 691cm⁻¹

実施例 73

5-(3-(4-(4-クロロベンゼンスルホニル)ウレイド)-4-シアノ-3-メチル-1-フェニル (1H)-ピラゾールの合成

IR (KBr) 3440, 1652, 1352, 1318, 1213, 1136, 996cm⁻¹

5-(3-(4-(4-クロロベンゼンスルホニル)ウレイド)-4-シアノ-3-メチル-1-フェニル (1H)-ピラゾールの合成

IR (KBr) 3440, 1652, 1352, 1318, 1213, 1136, 996cm⁻¹

5-(3-(4-(4-クロロベンゼンスルホニル)ウレイド)-4-シアノ-3-メチル-1-フェニル (1H)-ピラゾールの合成

IR (KBr) 3440, 1652, 1352, 1318, 1213, 1136, 996cm⁻¹

5-(3-(4-(4-クロロベンゼンスルホニル)ウレイド)-4-シアノ-3-メチル-1-フェニル (1H)-ピラゾールの合成

IR (KBr) 3440, 1652, 1352, 1318, 1213, 1136, 996cm⁻¹

5-(3-(2-クロロベンゼンスルホニル)ウレイド)-3-メチル-1-フェニル (1H)-ピラゾールの合成

製造例 1 の方法に準じて 5-アミノ-3-メチル-1-フェニル (1H)-ピラゾール [J. Org. Chem., 615

5, 58, (1993) より公知] と 2-クロロベンゼンスルホニルイソシアナートより 5-(3-(2-クロロベン

ゼンスルホニル)ウレイド)-3-メチル-1-フェニル (1H)-ピラゾールの合成した。融点 110-113℃

実施例 77

5-(3-(2-クロロベンゼンスルホニル)ウレイド)-3-メチル-1-シクロヘキシル (1H)-ピラゾールの合成

製造例 1 の方法に準じて 5-アミノ-3-メチル-1-シクロヘキシル (1H)-ピラゾール [J. Heterocycl. Chem., 523, 12, (1975) より公知] と 2-クロロ

ベンゼンスルホニルイソシアナートより 5-(3-(2-クロロベンゼンスルホニル)ウレイド)-3-メチル

-1-シクロヘキシル (1H)-ピラゾールの合成した。融点 187-189℃

実施例 78

5-(3-(4-メチルベンゼンスルホニル)ウレイド)-3-メチル-1-フェニル (1H)-ピラゾールの合成

製造例 1 の方法に準じて 5-アミノ-3-メチル-1-フェニル (1H)-ピラゾール [J. Org. Chem., 615

5, 58, (1993) より公知] と 4-メチルベンゼンスルホニルイソシアナートより 5-(3-(4-メチル

ベンゼンスルホニル)ウレイド)-3-メチル-1-フェニル (1H)-ピラゾールの合成した。融点 100-103℃

【0062】実施例 79

5-(3-(4-カルボキシベンゼンスルホニル)ウレイド)-3-メチル-1-フェニル (1H)-ピラゾールの合成

製造例 1 の方法に準じて 5-アミノ-3-メチル-1-フェニル (1H)-ピラゾール [J. Org. Chem., 615

5, 58, (1993) より公知] と 4-カルボキシベンゼンスルホニルイソシアナートより 5-(3-(4-カルボキシ

ベンゼンスルホニル)ウレイド)-3-メチル-1-フェニル (1H)-ピラゾールの合成した。融点 100-103℃

【0062】実施例 79

5-(3-(4-カルボキシベンゼンスルホニル)ウレイド)-3-メチル-1-フェニル (1H)-ピラゾールの合成

製造例 1 の方法に準じて 5-アミノ-3-メチル-1-フェニル (1H)-ピラゾール [J. Org. Chem., 615

5, 58, (1993) より公知] と 4-カルボキシベンゼンスルホニルイソシアナートより 5-(3-(4-カルボキシ

ベンゼンスルホニル)ウレイド)-3-メチル-1-フェニル (1H)-ピラゾールの合成した。融点 100-103℃

実施例 80

5-(3-(ベンジルスルホニル)ウレイド)-3-メチル-1-フェニル (1H)-ピラゾールの合成

製造例 1 の方法に準じて 5-アミノ-3-メチル-1-フェニル (1H)-ピラゾール [J. Org. Chem., 615

5, 58, (1993) より公知] と 4-ベンジルスルホニルイソシアナートより 5-(3-(4-ベンジルスルホニル)ウレイド)-3-メチル-1-フェニル (1H)-ピラゾールの合成した。融点 154-156℃

実施例 76

5-(3-(4-メトキシカルボニル)ウレイド)-3-メチル-1-フェニル (1H)-ピラゾールの合成

チル-1-フェニル (1H)-ピラゾールの合成

製造例 1 の方法に準じて 5-アミノ-3-メチル-1-フェニル (1H)-ピラゾール [J. Org. Chem., 615

5, 58, (1993) より公知] と ベンジルスルホニルイソシアナート [J. Org. Chem., 1597, 39, (1974) より

公知] より 5-(3-(ベンジルスルホニル)ウレイド)-3-メチル-1-フェニル (1H)-ピラゾールの合成した。融点 163-165℃

実施例 81

5-(3-(4-メトキシベンゼンスルホニル)ウレイド)-3-メチル-1-フェニル (1H)-ピラゾールの合成

製造例 1 の方法に準じて 5-アミノ-3-メチル-1-フェニル (1H)-ピラゾール [J. Org. Chem., 615

5, 58, (1993) より公知] と 4-メトキシベンゼンスルホニルイソシアナート [DE1289526 より公知] より

5-(3-(4-メトキシベンゼンスルホニル)ウレイド)-3-メチル-1-フェニル (1H)-ピラゾールの合成した。融点 110-113℃

実施例 82

5-(3-(4-(2-ピリジン-1-カルボニル)ウレイド)-3-メチル-1-フェニル (1H)-ピラゾールの合成

3-メチル-1-フェニル (1H)-ピラゾール [J. Org. Chem., 615

5, 58, (1993) より公知] と 2-ピリジン-1-カルボニルイソシアナートより 5-(3-(4-(2-ピリジン-1-カルボニル)ウレイド)-3-メチル-1-フェニル (1H)-ピラゾールの合成した。融点 110-113℃

実施例 83

5-(3-(4-(2-ピリジン-1-カルボニル)ウレイド)-3-メチル-1-フェニル (1H)-ピラゾールの合成

3-メチル-1-フェニル (1H)-ピラゾール [J. Org. Chem., 615

5, 58, (1993) より公知] と 2-ピリジン-1-カルボニルイソシアナートより 5-(3-(4-(2-ピリジン-1-カルボニル)ウレイド)-3-メチル-1-フェニル (1H)-ピラゾールの合成した。融点 110-113℃

5-(3-(4-(2-ピリジン-1-カルボニル)ウレイド)-3-メチル-1-フェニル (1H)-ピラゾールの合成

3-メチル-1-フェニル (1H)-ピラゾール [J. Org. Chem., 615

5, 58, (1993) より公知] と 2-ピリジン-1-カルボニルイソシアナートより 5-(3-(4-(2-ピリジン-1-カルボニル)ウレイド)-3-メチル-1-フェニル (1H)-ピラゾールの合成した。融点 110-113℃

実施例 84

5-(3-(4-(2-ピリジン-1-カルボニル)ウレイド)-3-メチル-1-フェニル (1H)-ピラゾールの合成

3-メチル-1-フェニル (1H)-ピラゾール [J. Org. Chem., 615

5, 58, (1993) より公知] と 2-ピリジン-1-カルボニルイソシアナートより 5-(3-(4-(2-ピリジン-1-カルボニル)ウレイド)-3-メチル-1-フェニル (1H)-ピラゾールの合成した。融点 110-113℃

実施例 85

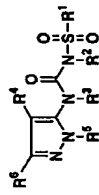
5-(3-(4-(2-ピリジン-1-カルボニル)ウレイド)-3-メチル-1-フェニル (1H)-ピラゾールの合成

3-メチル-1-フェニル (1H)-ピラゾール [J. Org. Chem., 615

5, 58, (1993) より公知] と 2-ピリジン-1-カルボニルイソシアナートより 5-(3-(4-(2-ピリジン-1-カルボニル)ウレイド)-3-メチル-1-フェニル (1H)-ピラゾールの合成した。融点 110-113℃

5-(3-(4-(2-ピリジン-1-カルボニル)ウレイド)-3-メチル-1-フェニル (1H)-ピラゾールの合成

3-メチル-1-フェニル (1H)-ピラゾール [J. Org. Chem., 615



【表131】

実施例	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
1	Ph	H	H	CN	Ph	H
2	4-Me-Ph	H	H	CN	2-pyridyl	H
3	4-Me-Ph	H	H	CN	Me	H
4	4-Me-Ph	H	H	CN	Cyclohexyl	H
5	4-Me-Ph	H	H	CN		H
6	4-Me-Ph	H	H	CN	4-NO ₂ -Ph	H
7	4-Me-Ph	H	H	CN	4-NH ₂ -Ph	H
8	4-Me-Ph	H	H	CN	4-AcNH-Ph	H
9	4-Me-Ph	H	H	CN	4-Me-Ph	H
10	4-Me-Ph	H	H	CN	4-Cl-Ph	H
11	4-Me-Ph	H	H	CN	4-Br-Ph	H
12	4-Me-Ph	H	H	CN		H
13	4-Me-Ph	H	H	CN		H
14	4-Me-Ph	H	H	CN	PhCH ₂	H
15	4-Me-Ph	H	H	CN		H
16	4-Me-Ph	H	H	CN	2-NO ₂ -Ph	H
17	4-Me-Ph	H	H	CN	2-NH ₂ -Ph	H
18	4-Me-Ph	H	H	CN	2-Me-Ph	H





【表132】

実施例	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
19	4-Me-Ph	H	H	CN	2-Cl-Ph	H
20	2-Me-Ph	H	H	CN	Ph	H
21	2-Me-Ph	H	H	CN	Cyclohexyl	H
22	2-Me-Ph	H	H	H	Ph	H
23	4-Me-Ph	H	H	CO ₂ Et	Ph	H
24	4-Me-Ph	H	H	CO ₂ H	Ph	H
25	4-Me-Ph	H	H	CN	Ph	Me
26	2-Me-Ph	H	H	CN	Ph	Me
27	4-Me-Ph	H	H	CN	Ph	Et
28	2-Me-Ph	H	H	CN	Ph	Et
29	4-Me-Ph	H	H	CN	Ph	^t Bu
30	2-Me-Ph	H	H	CN	Ph	^t Bu
31	4-Me-Ph	H	H	CN	Ph	Ph
32	2-Me-Ph	H	H	CN	Ph	Ph
33	4-Me-Ph	H	H	CN	Ph	CH ₂ CN
34	4-Me-Ph	H	H	CN	Ph	CH ₂ CO ₂ Et

【表133】



実施例	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
35	4-Me-Ph	H	H	CN	Ph	CH ₂ CO ₂ H
36	4-Cl-Ph	H	H	CN	Ph	H
37	4-Cl-Ph	H	H	CN	Ph	Me
38	4-Cl-Ph	H	H	CN	Ph	Et
39	4-Cl-Ph	H	H	CN	Ph	Me ₂ N(CH ₂) ₂
40	4-NO ₂ -Ph	H	H	CN	Ph	H
41	4-NH ₂ -Ph	H	H	CN	Ph	H
42	4-Me-Ph	H	H	CN	Ph	ⁱ Pr
43	4-Cl-Ph	H	H	CN	Ph	ⁱ Pr
44	実施例化合物37のナトリウム塩					
45	実施例化合物25のナトリウム塩					
46	実施例化合物4のナトリウム塩					
47	4- ⁱ Pr-Ph	H	H	CN	Ph	H
48	4- ⁱ Pr-Ph	H	H	CN	Ph	Me
49	4-Cl-Ph	H	H	CN	Ph	H
50	4-Cl-Ph	H	H	CN	Ph	Me

【表134】




実施例	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
51	4-Cl-Ph	Me	-H	-CN	Ph	Me
52	4-Cl-Ph	-H	PhCH ₂ -	-CN	Ph	Me
53	4-Cl-Ph	-H	-H	-CN		Me
54	4-Cl-Ph	-H	Me	-CN	Ph	Me
55	4-Cl-Ph	-H	-H	-CN		Me
56	4-Cl-Ph	PhCH ₂ -	-H	-CN	Ph	Me
57	4-Br-Ph	-H	-H	-CN	Ph	Me
58	4-Cl-Ph	-H	Pr-	-CN	Ph	Me
59	4-Cl-Ph	-H	Me ₂ N(CH ₂) ₂ -	-CN	Ph	Me
60	4-Cl-Ph	-H		-CN	Ph	Me
61	4-Cl-Ph	-H	-H	-CN		Me
62	実施例化合物50のナトリウム塩					
63	4-Cl-Ph	-H	-H	-CN	MeOCO ₂ (CH ₂) ₂ -	Me
64	4-Cl-Ph	-H	-H	-CN	-(CH ₂) ₂ -OH	Me
65	4-Cl-Ph	-H	MeO(CH ₂) ₂ -	-CN	Ph	Me
66	4-Cl-Ph	-H	-H	-CN	CH ₂ =CH-	Me
67	4-Cl-Ph	-H	-H	-CN	Et-	Me

【表135】

実施例

実施例	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
68	4-Cl-Ph	-H	-H	-CN	MeO(CH ₂) ₂ -	Me
69		-H	-H	-H	Ph-	Me
70	4-Et-Ph	-H	-H	-H	Ph-	Me
71	Me	-H	-H	-CN	Ph-	Me
72	4- ^t Bu-Ph	-H	-H	-H	Ph-	Me
73	4-Cl-Ph	-H	-H	-CN	Me ₂ N(CH ₂) ₂ -	Me
74	4-Cl-Ph	-H	-H	-H	Cyclohexyl-	Me
75	4-MeO ₂ C-Ph	-H	-H	-H	Ph-	Me
76	2-Cl-Ph	-H	-H	-H	Ph-	Me
77	2-Cl-Ph	-H	-H	-H	Cyclohexyl-	Me
78	4- ^t Bu-Ph	-H	-H	-H	Ph-	Me
79	4-HO ₂ C-Ph	-H	-H	-H	Ph-	Me
80	PhCH ₂ -	-H	-H	-H	Ph-	Me
81	4-MeO-Ph	-H	-H	-H	Ph-	Me
82		-H	-H	-H	Ph-	Me
83	4-HOCH ₂ -Ph	-H	-H	-H	Ph-	Me

【表136】

実施例	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
84		-H	-H	-H	-H	Me
85		-H	-H	-H	-H	Me
86	3-Me-Ph-	-H	-H	-H	-H	Me
87	4-Ph-Ph-	-H	-H	-H	-H	Me
88	3-Cl-Ph-	-H	-H	-H	-H	Me
89		-H	-H	-H	-H	Me
90	4-Cl-Ph-	-H	-H	-CN	-CN	-CH ₂ CO ₂ Et
91	4-Cl-Ph-	-H	-H	-CN	-CN	-CH ₂ CO ₂ H
92	4-Cl-Ph-	-H	-H	-CN	-CN	-(CH ₂) ₂ OH
93	4-Ph-Ph-	-H	-H	-H	-H	Me

【0068】

【発明の効果】

試験例1 5-スルホニルウレイドピラゾール誘導体のECE阻害作用

方法

ラット肺ECEの調製とECE阻害活性の測定
ラット肺組織を5mM 塩化マグネシウム、1mM フッ化フェニルメチルスルホニル (PMSF)、20μM ペプスタチンA、20μM ロイペプチンを含む20mM トリス-塩酸緩衝液 (pH7.5) 中で氷冷下ホモジナイザーでホモジナイズした。800×g で遠心し、その上清を100,000×g で超遠心し沈殿として得、上配緩衝液にて懸濁し超遠心分離する操作をさらに2度繰り返し、血漿成分などを洗浄した。その沈殿を懸濁し、ガラスホモジナイザーでホモジナイズし、超遠心分離した。最終的に得られた沈殿を0.5% Triton X-100

スルホニルウレイドピラゾール誘導体のECE阻害活性

本発明化合物	IC50 (μM)
製造例1	4.6
実施例4	0.29
実施例37	0.045

試験例2 ラットにおけるbig ET-1 誘発血圧変化に対する作用

方法

雄性SD系ラット (体重230~280g) をチオバル

ビタールナトリウム (65mg/kg 体重、腹腔内投与) で麻酔下、加温した手術台に固定し、右大動脈および静脈にカテーテルを挿入して、それぞれ血圧測定および薬物投与用とした。ラットにペントリニウム (10mg/kg

) を腹腔内投与し、神経節遮断した。約10分の平衡期間の後に、溶媒 (ポリエチレングリコール400) および試験化合物を静脈内投与した (0.5ml/kg)。その15分後にbig ET-1 (1nmol/kg) を静脈内投与した。big ET-1 による血圧変化を指標としたラット in vivo における試験化合物のECE阻害活性は、溶媒

結果

実施例37の化合物を投与 (3および10mg/kg) することにより、big ET-1 誘発血圧反応はそれぞれ表138のように明らかに抑制された。

【表138】

投与量 (mg/kg)	収縮期血圧の増加量 (mmHg)
0	96±4
3	65±8
10	34±6

参考例

製造例1の化合物はECE 以外のメタロプロテアーゼ、例えば、エンドペプチダーゼ、ストロメリンなどに対して阻害活性は10⁻⁵Mで20%以下であり、ECEに対して、選択性の高いものであった。

【0069】この様に本発明化合物は優れたエンドセリ変換酵素阻害作用を有し、従ってETに起因する、または起因すると考えられる各種疾患、例えば循環器系の疾患 (例えば心筋虚血、うっ血性心不全、不整脈、不安

定狭心症、心肥大、高血圧)、気管収縮 (肺性高血圧、喘息)、神経性障害 (脳血管梗塞、くも膜下出血、脳卒中、脳脊髄、アルツハイマー病)、分泌系不全 (子宮症)、血管障害 (動脈硬化、パーリヤー病、高血圧、炎症、レイノー病、糖尿病の合併症)、潰瘍 (胃潰瘍)、腫瘍 (肺がん)、腎臓障害、エンドトキシンショック、敗血症、腎臓病 (急性および慢性腎不全) などの治療薬および予防薬として有用である。

フロントページの続き

(51) Int. Cl. 6	識別記号	序内整理番号	F I	技術表示箇所
A 61 K 31/415	ACD		A 61 K 31/415	ACD
	ACU			ACJ
	ACL			ACL
	ACV			ACV
	AED			AED
31/44			31/44	
C 07 D 231/38			C 07 D 231/38	B
401/04	231		401/04	231
405/04	231		405/04	231
409/04	231		409/04	231

(72)発明者 大橋 尚仁

大阪市此花区春日中3丁目1番98号 住友製薬株式会社内